PCT/JP97/02635
30.07.97
09/214277

# 日 本 国 特 許 庁
PATENT OFFICE
JAPANESE GOVERNMENT

REC'D 30 SEP 1997
WIPO PCT

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出願年月日
Date of Application: １９９６年１０月３０日

出願番号
Application Number: 平成 ８年特許願第２８７７８２号

出願人
Applicant (s): 塩野義製薬株式会社

PRIORITY DOCUMENT

１９９７年 ９月 ５日

特許庁長官
Commissioner,
Patent Office 荒井寿光

出証番号 出証特平０９－３０７０６９０

【書類名】　特許願

【整理番号】　A005644

【提出日】　平成 8年10月30日

【あて先】　特許庁長官　殿

【国際特許分類】　A61K 31/00

C07C 39/00

【発明の名称】　新規パラテルフェニル化合物

【請求項の数】　9

【発明者】

【住所又は居所】　大阪府豊中市新千里西町３－１－Ｃ２２－１０７

【氏名】　川田　健司

【発明者】

【住所又は居所】　奈良県奈良市高畑町１３４２

【氏名】　大谷　光昭

【特許出願人】

【識別番号】　000001926

【氏名又は名称】　塩野義製薬株式会社

【代表者】　塩野　芳彦

【代理人】

【識別番号】　100103230

【弁理士】

【氏名又は名称】　高山　裕貢

【電話番号】　06-202-2161

【先の出願に基づく優先権主張】

【出願番号】　平成 8年特許願第201859号

【出願日】　平成 8年 7月31日

【手数料の表示】

【予納台帳番号】　044602

【納付金額】　21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】　明細書　1

【物件名】　要約書　1

【包括委任状番号】　9505451

【プルーフの要否】　要

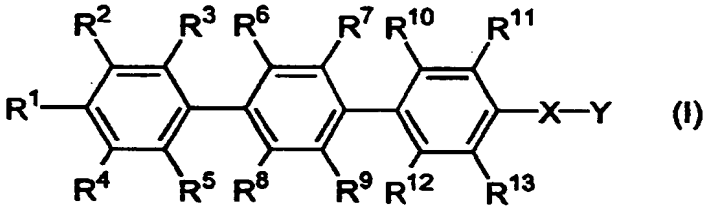
【書類名】　明細書

【発明の名称】　新規パラテルフェニル化合物

【特許請求の範囲】

【請求項１】　式（Ｉ）：

【化１】



(I)

[式中、

$R^1$、$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$、$R^6$、$R^7$、$R^8$、$R^9$、$R^{10}$、$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Ｘは－Ｏ－、－$CH_2$－、－$NR^{14}$－（ここで$R^{14}$は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または－ＳＯｐ－（ここでｐは０～２の整数）であり、

Ｙは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Ｘが－$CH_2$－であるときはＹは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、$R^1$および$R^4$、$R^1$および$R^2$、$R^2$および$R^3$、$R^4$および$R^5$、$R^6$および$R^7$、$R^8$および$R^9$、$R^{10}$および$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$、$R^{11}$、XおよびYまたは$R^{13}$、XおよびYは一緒になってO、SまたはN$R^{15}$（ここで$R^{15}$は水素または低級アルキル）を１以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい５～６員環を形成してもよい。

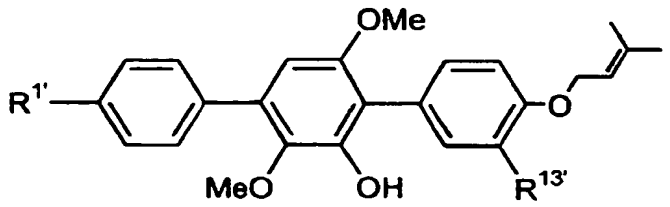
ただし、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$のうち１以上がハロゲンであり、それ以外が水素である場合、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$が全てハロゲンである場合、および$R^2$～$R^{13}$が全て水素である場合を除く。

また、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$が同時に全て水素であるとき、$R^1$は水素、フッ素、置換基を有していてもよい低級アルキルまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシでないか、または$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$および$R^{12}$は全て水素であるか、または$R^{13}$は水素もしくはハロゲンでない。

さらに$R^6$、$R^7$、$R^8$または$R^9$の少なくとも１つが水素以外の基であるとき、$R^1$はメチルまたはアセチルオキシでないか、または$R^{13}$は水素、置換されていてもよい低級アルキルオキシカルボニルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルでないか、または－X－Yはメチルオキシでない。

また、式（I'）：

【化２】




(I')

（式中、$R^{1'}$は水素またはヒドロキシであり、$R^{13'}$はヒドロキシまたはメトキシである）

で示される化合物を除く。］

で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項２】　$R^1$、$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$、$R^6$、$R^7$、$R^8$、$R^9$、$R^{10}$、$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置

換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは－O－、$-CH_2-$、$-NR^{14}-$（ここで$R^{14}$は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または－SOp－（ここでpは0～2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシルまたは置換基を有していてもよいシクロアルケニルであり、また$R^1$および$R^4$、$R^1$および$R^2$、$R^{11}$、XおよびYまたは$R^{13}$、XおよびYは一緒になってOを1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい、請求項1記載の化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物。

【請求項3】　$R^1$が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいアミノであり、$R^2$が水素、ヒドロキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシであり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$および$R^8$が各々独立して水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$が水素、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していて

もよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$が水素、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルであり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルであり、Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニルまたは置換基を有していてもよいシクロアルケニルであり、$R^{1}$および$R^{2}$、$R^{1}$および$R^{4}$、$R^{11}$、XおよびYまたは$R^{13}$、XおよびYは一緒になって、Oを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい、請求項1記載の化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物。

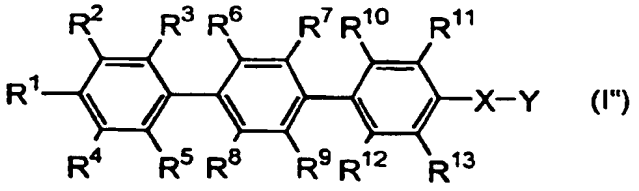
【請求項4】　請求項1記載の化合物を有効成分とする医薬。

【請求項5】　請求項1記載の化合物を有効成分とする免疫抑制剤。

【請求項6】　請求項1記載の化合物を有効成分とする抗アレルギー剤。

【請求項7】　式（I''）：

【化3】




(I'')

[式中、

$R^{1}$、$R^{2}$、$R^{3}$、$R^{4}$、$R^{5}$、$R^{6}$、$R^{7}$、$R^{8}$、$R^{9}$、$R^{10}$、$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニル

オキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

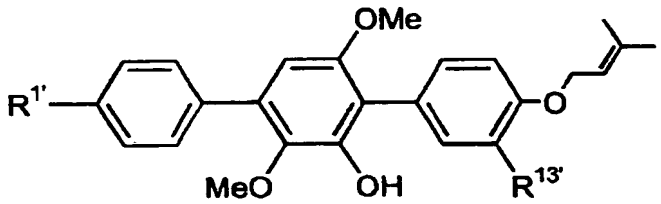
Xは－Ｏ－、－$CH_2$－、－$NR^{14}$－（ここで$R^{14}$は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または－ＳＯｐ－（ここでｐは０～２の整数）であり、

Ｙは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Ｘが－$CH_2$－であるときはＹは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、$R^1$および$R^4$、$R^1$および$R^2$、$R^2$および$R^3$、$R^4$および$R^5$、$R^6$および$R^7$、$R^8$および$R^9$、$R^{10}$および$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$、$R^{11}$、ＸおよびＹ、並びに$R^{13}$、ＸおよびＹは一緒になってＯ、ＳまたはＮ$R^{15}$（ここで$R^{15}$は水素または低級アルキル）を１以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい５～６員環を形成してもよい。

ただし、式（Ｉ'）：

【化４】




(I')

（式中、$R^{1'}$は水素またはヒドロキシであり、$R^{13'}$はヒドロキシまたはメトキシである）

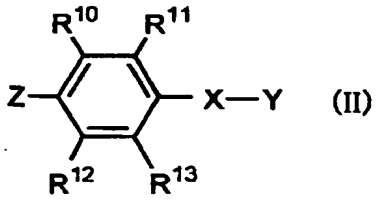
で示される化合物を除く。］

で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物を有効成分とする免疫抑制剤。

【請求項8】　請求項7記載の式（I''）で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物を有効成分とする抗アレルギー剤。

【請求項9】　式（II）：

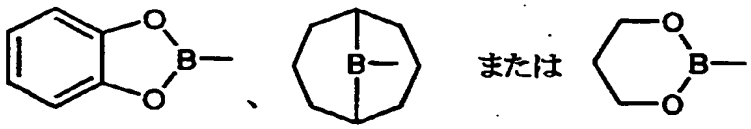
【化5】



(II)

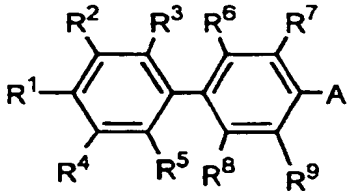
（式中、$R^{10}$～$R^{13}$、XおよびYは請求項1と同義であり、Zはジヒドロキシボラン、ジ低級アルコキシボラン、ジ低級アルキルボラン、

【化6】




である）で示される化合物と式（III）：

【化7】

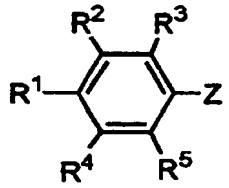


(III)

（式中、$R^{1}$～$R^{9}$は請求項1と同義であり、Aはハロゲンまたは－$OSO_2$（$C_qF_{2q+1}$）（ここでqは0～4の整数）である）

で示される化合物を反応させるか、または式（II'）：

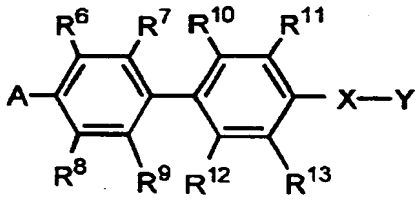
【化８】



(II')

（式中、$R^1$～$R^5$は請求項１と同義であり、Ｚは前記と同義）
で示される化合物と式（III'）：

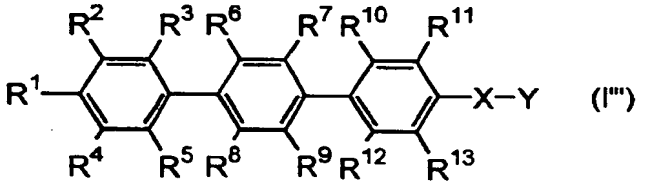
【化９】



(III')

（式中、$R^6$～$R^{13}$、ＸおよびＹは請求項１と同義であり、Ａは前記と同義）
で示される化合物を反応させることを特徴とする、式（I'''）：

【化１０】



(I''')

[式中、
$R^1$、$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$、$R^6$、$R^7$、$R^8$、$R^9$、$R^{10}$、$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置

換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは－O－、－$CH_2$－、－$NR^{14}$－（ここで$R^{14}$は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または－SOp－（ここでpは0～2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが－$CH_2$－であるときはYは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、$R^1$および$R^4$、$R^1$および$R^2$、$R^2$および$R^3$、$R^4$および$R^5$、$R^6$および$R^7$、$R^8$および$R^9$、$R^{10}$および$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$、$R^{11}$、XおよびY、並びに$R^{13}$、XおよびYは一緒になってO、Sまたは$NR^{15}$（ここで$R^{15}$は水素または低級アルキル）を1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい。

ただし、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$のうち1以上がハロゲンであり、それ以外が水素である場合、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$が全てハロゲンである場合、および$R^2$～$R^{13}$が全て水素である場合を除く。

また、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$が同時に全て水素であるとき、$R^1$は水素、フッ素、置換基を有していてもよい低級アルキルまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシでないか、または$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$および$R^{12}$は全て水素であるか、または$R^{13}$は水素もしくはハロゲンでない。

さらに$R^6$、$R^7$、$R^8$または$R^9$の少なくとも1つが水素以外の基であるとき、$R^1$はメチルまたはアセチルオキシでないか、または$R^{13}$は水素、置換されていてもよい低級アルキルオキシカルボニルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルでないか、または－X－Yはメチルオキシでない。]

で示される化合物の製造方法。

【発明の詳細な説明】

【０００１】

【発明の属する技術分野】

本発明は医薬として有用な化合物とその製造方法、およびその用途に関する。詳しくは、免疫抑制作用および抗アレルギー作用を有する新規パラテルフェニル化合物とその製造方法、並びにそれを含有する免疫抑制剤および抗アレルギー剤に関する。

【０００２】

【従来の技術】

近年数多く行なわれるようになった移植手術の大きな課題は、術後の移植片に対する拒絶反応である。それを回避することが移植手術の成否を決定するといっても過言ではない。

そうした中で、アザチオプリン、コルチコイド、シクロスポリンＡやタクロリムス等種々の免疫抑制剤が開発・実用化され、臓器または組織移植に対する拒絶反応、骨髄移植によって起こる移植片対宿主反応の予防および治療に用いられている。しかし、これらも効果や副作用の点で必ずしも満足できるものではない。

【０００３】

また、アトピー性皮膚炎、アレルギー性鼻炎、気管支喘息等のアレルギー疾患の治療にはステロイド剤、抗ヒスタミン剤、ケミカルメディエーター遊離抑制剤、気管支拡張剤等が繁用されている。さらに、上述の免疫抑制剤もアレルギー性疾患の治療に用いられている。

しかし、いずれも強い副作用を有する、喘息の急性発作には効果が少ない、多剤の併用の必要がある、等の問題点を残しており、満足のいく治療効果をもたらすものではなく、根本的なアレルギー性疾患の治療剤とはなっていない。

【０００４】

本発明に係る化合物と同系統の化合物が、ケミカル・アンド・ファーマシューティカル・ビューリチン（Ｃｈｅｍｉｃａｌ　＆　Ｐｈａｒｍａｃｅｕｔｉｃａｌ　Ｂｕｌｌｅｔｉｎ，２４（４），６１３－６２０（１９７６））、ザ・ジャーナル・オブ・アンチバイオチックス（Ｔｈｅ　Ｊｏｕｒｎａｌ　ｏｆ　Ａｎｔ

ｉｂｉｏｔｉｃｓ，３２（６），５５９－５６４（１９７９））およびアグリカルチュアル・バイオロジカル・ケミストリー（Ａｇｒｉｃｕｌｔｕｒａｌ　Ｂｉｏｌｏｇｉｃａｌ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ，４９（３），８６７－８６８（１９８５））等に記載されている。これらの文献には、ウニの胚細胞やヒラ細胞に対して毒性を有することが開示されているが、免疫抑制作用および抗アレルギー作用については全く言及されていない。

【０００５】

【発明が解決しようとする課題】

本発明の目的は、優れた免疫抑制作用および／または抗アレルギー作用を有する新規化合物、その製造方法およびそれを含有する免疫抑制剤および抗アレルギー剤を提供することにある。

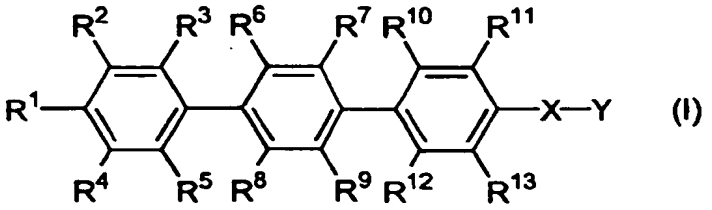
【０００６】

【課題を解決するための手段】

本発明は、式（Ｉ）：

【０００７】

【化１１】




(I)

[式中、

$R^1$、$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$、$R^6$、$R^7$、$R^8$、$R^9$、$R^{10}$、$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホル

ミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは－O－、－$CH_2$－、－$NR^{14}$－（ここで$R^{14}$は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または－SOp－（ここでpは0～2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが－$CH_2$－であるときはYは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、$R^1$および$R^4$、$R^1$および$R^2$、$R^2$および$R^3$、$R^4$および$R^5$、$R^6$および$R^7$、$R^8$および$R^9$、$R^{10}$および$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$、$R^{11}$、XおよびYまたは$R^{13}$、XおよびYは一緒になってO、Sまたは$NR^{15}$（ここで$R^{15}$は水素または低級アルキル）を1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい。

【0008】

ただし、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$のうち1以上がハロゲンであり、それ以外が水素である場合、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$が全てハロゲンである場合、および$R^2$～$R^{13}$が全て水素である場合を除く。

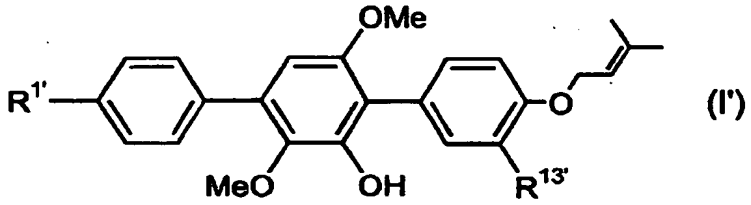
また、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$が同時に全て水素であるとき、$R^1$は水素、フッ素、置換基を有していてもよい低級アルキルまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシでないか、または$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$および$R^{12}$は全て水素であるか、または$R^{13}$は水素もしくはハロゲンでない。

さらに$R^6$、$R^7$、$R^8$または$R^9$の少なくとも1つが水素以外の基であるとき、$R^1$はメチルまたはアセチルオキシでないか、または$R^{13}$は水素、置換されていてもよい低級アルキルオキシカルボニルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルでないか、または－X－Yはメチルオキシでない。

【0009】

また、式（I'）：

【化12】




(I')

（式中、$R^{1'}$は水素またはヒドロキシであり、$R^{13'}$はヒドロキシまたはメトキシである）

で示される化合物を除く。]

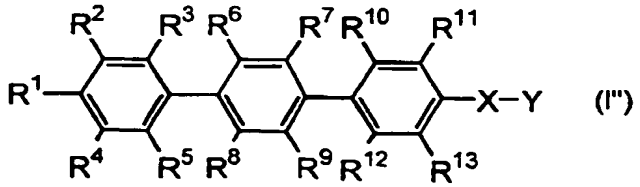
で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物を提供するものである。

また、本発明は化合物（I）を有効成分とする医薬、詳しくは免疫抑制剤および／または抗アレルギー剤を提供する。

【0010】

さらに、本発明は式（I''）：

【化13】




(I'')

[式中、

$R^1$、$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$、$R^6$、$R^7$、$R^8$、$R^9$、$R^{10}$、$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよ

い低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは－Ｏ－、－$CH_2$－、－$NR^{14}$－（ここで$R^{14}$は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または－ＳＯｐ－（ここでｐは０～２の整数）であり、

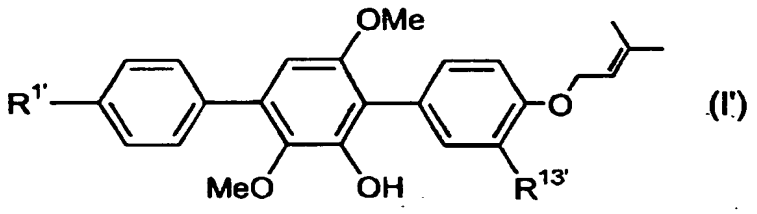
Ｙは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Ｘが－$CH_2$－であるときはＹは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、$R^1$および$R^4$、$R^1$および$R^2$、$R^2$および$R^3$、$R^4$および$R^5$、$R^6$および$R^7$、$R^8$および$R^9$、$R^{10}$および$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$、$R^{11}$、ＸおよびＹ、並びに$R^{13}$、ＸおよびＹは一緒になってＯ、ＳまたはＮ$R^{15}$（ここで$R^{15}$は水素または低級アルキル）を１以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい５～６員環を形成してもよい。

【００１１】

ただし、式（Ｉ'）：

【化１４】




(I')

（式中、$R^{1'}$は水素またはヒドロキシであり、$R^{13'}$はヒドロキシまたはメトキシである）

で示される化合物を除く。]

で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物を有効

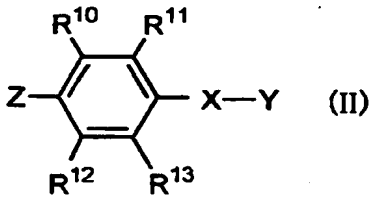
成分とする免疫抑制剤および／または抗アレルギー剤を提供する。

さらに、化合物（Ｉ）または（Ｉ’’）を投与することを特徴とする、免疫反応の抑制の方法、アレルギー性疾患の治療の方法または予防の方法を提供する。さらに別の態様として、免疫反応の抑制、アレルギー性疾患の治療または予防のための医薬を製造するための、化合物（Ｉ）または（Ｉ’’）の使用を提供する。

【００１２】

さらに別の態様として、本発明は式（ＩＩ）：

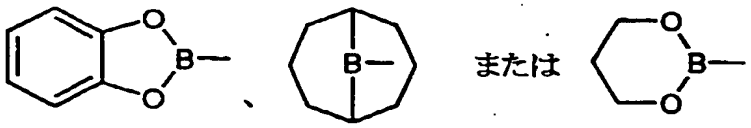
【化１５】



(II)

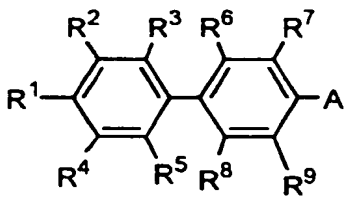
（式中、$R^{10}$～$R^{13}$、ＸおよびＹは前記式（Ｉ）における場合と同義であり、Ｚはジヒドロキシボラン、ジ低級アルコキシボラン、ジ低級アルキルボラン、

【化１６】




である）で示される化合物と式（III）：

【化１７】

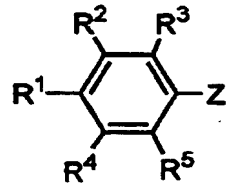


(III)

（式中、$R^{1}$～$R^{9}$は前記式（Ｉ）における場合と同義であり、Ａはハロゲンまたは－ＯＳＯ$_2$（$C_qF_{2q+1}$）（ここでｑは０～４の整数）である）

で示される化合物を反応させるか、または式（ＩＩ’）：

【化１８】

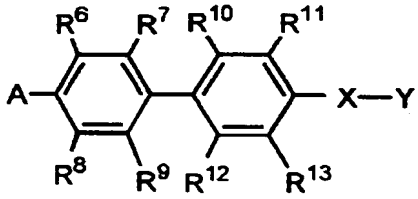


(II')

（式中、$R^1$～$R^5$は前記式（Ｉ）における場合と同義であり、Ｚは前記式（ＩＩ）における場合と同義である）

で示される化合物と式（III’）：

【化１９】



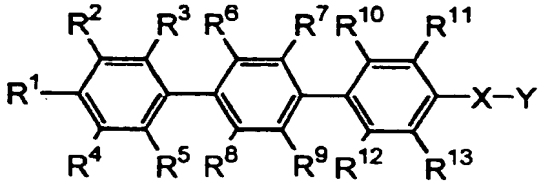
(III')

（式中、$R^6$～$R^{13}$、ＸおよびＹは前記式（Ｉ）における場合と同義であり、Ａは前記式（III）における場合と同義）

で示される化合物を反応させることを特徴とする、式（Ｉ’’’）：

【００１３】

【化２０】



(I''')

[式中、

$R^1$、$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$、$R^6$、$R^7$、$R^8$、$R^9$、$R^{10}$、$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有してい

てもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ニトロ、シアノ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、

Xは－O－、－$CH_2$－、－$NR^{14}$－（ここで$R^{14}$は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または－SOp－（ここでpは0～2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが－$CH_2$－であるときはYは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

また、$R^1$および$R^4$、$R^1$および$R^2$、$R^2$および$R^3$、$R^4$および$R^5$、$R^6$および$R^7$、$R^8$および$R^9$、$R^{10}$および$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$、$R^{11}$、XおよびY、並びに$R^{13}$、XおよびYは一緒になってO、Sまたは$NR^{15}$（ここで$R^{15}$は水素または低級アルキル）を1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい。

ただし、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$のうち1以上がハロゲンであり、それ以外が水素である場合、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$が全てハロゲンである場合、および$R^2$～$R^{13}$が全て水素である場合を除く。

また、$R^6$、$R^7$、$R^8$および$R^9$が同時に全て水素であるとき、$R^1$は水素、フッ素、置換基を有していてもよい低級アルキルまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシでないか、または$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$および$R^{12}$は全て水素であるか、または$R^{13}$は水素もしくはハロゲンでない。

さらに$R^6$、$R^7$、$R^8$または$R^9$の少なくとも1つが水素以外の基であるとき、R

$^{1}$はメチルまたはアセチルオキシでないか、または$R^{13}$は水素、置換されていてもよい低級アルキルオキシカルボニルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルでないか、または－Ｘ－Ｙはメチルオキシでない。］
で示される化合物の製造方法を提供するものである。

【００１４】

本明細書中において、「ハロゲン」とは、フッ素、塩素、臭素およびヨウ素を包含する。特にフッ素および塩素が好ましい。

「低級アルキル」とは、炭素数１～１０の直鎖または分枝状のアルキルを意味し、例えばメチル、エチル、ｎ－プロピル、イソプロピル、ｎ－ブチル、イソブチル、ｓｅｃ－ブチル、ｔｅｒｔ－ブチル、ｎ－ペンチル、イソペンチル、ネオペンチル、ヘキシル、イソヘキシル、ヘプチル、イソヘプチル、オクチル、イソオクチル、ノニル、デシル等を包含する。「置換基を有していてもよい低級アルキル」とは、任意の位置が１以上の置換基で置換されていてもよい低級アルキルを意味し、その置換基としてはヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよいイミノ、低級アルキルオキシ、低級アルキルオキシカルボニル、アシル、アシルオキシ、シクロアルキル、シクロアルケニル、置換基（例えば１以上の低級アルキル、ハロゲン、低級アルキルオキシ、カルボキシ、低級アルキルオキシカルボニル等）を有していてもよいアリールまたは置換基（低級アルキル等）を有していてもよいヘテロ環等が挙げられる。

「低級アルキルオキシ」、「低級アルキルチオ」、「低級アルキルスルホニルオキシ」のアルキル部分は上記「低級アルキル」と同様であり、「置換基を有していてもよい」の置換基部分も上記アルキルの置換基と同様である。

「低級アルキルオキシカルボニル」の低級アルキル部分も上記「低級アルキル」と同様である。「置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル」の置換基部分とはヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシ、低級アルキルオキシカルボニル、ヘテロ環等を包含し、１以上の任意の位置がこれらの置換基で置換されていてもよい。

【００１５】

「低級アルケニル」とは、炭素数２～１０の直鎖または分枝状のアルケニルを

意味する。具体的にはビニル、プロペニル、イソプロペニル、ブテニル、イソブテニル、ブタジエニル、ペンテニル、イソペンテニル、ペンタジエニル、ヘキセニル、イソヘキセニル、ヘキサジエニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、デセニル等を包含し、任意の位置に1以上の二重結合を有する。「置換基を有していてもよい低級アルケニル」の置換基としてはヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシ、シクロアルキル、低級アルキルオキシカルボニル、アリール、ヘテロ環等が挙げられ、１以上の任意の位置がこれらの置換基で置換されていてもよい。

「低級アルケニルオキシ」の低級アルケニル部分および「置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ」の置換基も上記と同様である。

【００１６】

「低級アルキニル」とは、炭素数２～１０の直鎖状または分枝状のアルキニルを意味し、具体的には、エチニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、デシニル等を包含する。これらは任意の位置に１以上の三重結合を有しており、さらに二重結合を有していてもよい。「置換基を有していてもよい低級アルキニル」の置換基とは上記低級アルケニルのものと同様である。

【００１７】

「アシル」とは炭素数１～１０のアシルを意味し、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、バレリル、ピバロイル、ヘキサノイル、アクリロイル、プロピオロイル、メタクリロイルおよびクロトノイル、シクロヘキサンカルボニル、ベンゾイル等を包含する。「置換基を有していてもよいアシル」の置換基とはヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシ、低級アルキルオキシカルボニル、アリールまたはヘテロ環等を意味し、１以上の任意の位置がこれらの置換基で置換されていてもよい。

「アシルオキシ」のアシル部分および「置換基を有していてもよいアシルオキシ」の置換基も上記アシルと同様である。

【００１８】

「シクロアルキル」とは炭素数３～６の炭素環であり、例えばシクロプロピル

、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等を包含する。「置換基を有していてもよいシクロアルキル」の置換基とはヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシカルボニル、低級アルキルオキシ、アリール、ヘテロ環等が挙げられ、１以上の任意の位置がこれらの置換基で置換されていてもよい。

「シクロアルケニル」とは、上記シクロアルキルの環中の任意の位置に１以上の二重結合を有しているものを意味し、具体的にはシクロプロペニル、シクロブテニル、シクロペンテニル、シクロヘキセニル、シクロヘキサジエニル等を包含する。「置換基を有していてもよいシクロアルケニル」の置換基は上記シクロアルキルのものと同様であり、１以上の任意の位置に置換基を有していてもよい。

【００１９】

「置換基を有していてもよいアミノ」とは、置換アミノおよび非置換アミノを包含し、置換基として１以上のヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキル等を有していてもよい。

「置換基を有していてもよいイミノ」とは、置換イミノおよび非置換イミノを包含し、置換基として例えばヒドロキシ、置換基（カルボキシ、アリール等）を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよいヘテロ環（低級アルキルピペラジノ、モルホリノ等）が挙げられる。

「置換基を有していてもよいカルバモイル」とは、置換カルバモイルおよび非置換カルバモイルを包含し、置換基は上記置換アミノのものと同様である。

「置換基を有していてもよいイミノ」とは、置換イミノおよび非置換イミノを包含し、置換基としてはヒドロキシ、置換基（カルボキシ、アリール等）を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基（低級アルキル等）を有していてもよいヘテロ環（ピペラジノ、モルホリノ等）が挙げられる。

【００２０】

「アリール」とは、フェニル、ナフチル、アントラセニル、インデニル、フェナンスレニル等を包含する。「置換基を有していてもよいアリール」の置換基としてはヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、低級アルキル、低級アルキルオキシ、低級アルキルオキシカルボニル、アリール、ヘテロ環等が挙げられ、１以上の任意の位置がこれらの置換基で置換されていてもよい。

「ヘテロ環」とは、O、SおよびNから任意に選択されるヘテロ原子を環内に1以上有するヘテロ環を意味し、具体的にはピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニル、トリアジニル、イソキサゾリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、イソチアゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、フリルおよびチエニル等の5～6員の芳香族ヘテロ環や、インドリル、ベンズイミダゾリル、インダゾリル、インドリジニル、キノリル、イソキノリル、シンノリニル、フタラジニル、キナゾリニル、ナフチリジニル、キノキサリニル、プテリジニル、ベンズイソキサゾリル、ベンズオキサゾリル、キサジアゾリル、ベンズイソチアゾリル、ベンズチアゾリル、ベンズチアジアゾリル、ベンゾフリル、ベンゾチエニル等の縮合芳香族ヘテロ環、エチレンオキシジニル、ジオキサニル、チイラニル、オキサチオラニル、アゼチジニル、チアニル、ピロリジニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホニル等の脂環式ヘテロ環を包含する。「置換基を有していてもよいヘテロ環」の置換基としては低級アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシカルボニル、低級アルキルオキシ、アリール、ヘテロ環等が挙げられ、1以上の任意の位置に置換基を有していてもよい。

【0021】

「O、SまたはNR$^{15}$を1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環」とは、R$^{1}$およびR$^{4}$、R$^{1}$およびR$^{2}$、R$^{2}$およびR$^{3}$、R$^{4}$およびR$^{5}$、R$^{6}$およびR$^{7}$、R$^{8}$およびR$^{9}$、R$^{10}$およびR$^{11}$、R$^{12}$およびR$^{13}$、R$^{11}$、XおよびY、並びにR$^{13}$、XおよびYが一緒になって－O（$CH_2$）mO－、－O（$CH_2$）n－、－（$CH_2$）nO－、－S（$CH_2$）mS－、－S（$CH_2$）n－、－（$CH_2$）nS－、－NH（$CH_2$）mNH－、－NH（$CH_2$）n－、－（$CH_2$）nNH－、－O（$CH_2$）mS－、－S（$CH_2$）mO－、－S（$CH_2$）mN－、－N（$CH_2$）mS－、－O（$CH_2$）mN－、－N（$CH_2$）mO－（mは1または2であり、nは2または3である）等を形成し、各々の置換基が結合しているフェニルの構成炭素原子2つと一緒になって5～6員環を形成することを意味する。これらの基はヒドロキシ、ハロゲン、置換基（低級アルキルオキシカルボニル等）を有していてもよい低級アルキル、置換基（ハロゲン等）を有し

ていてもよい低級アルケニル等の置換基を有していてもよい。

【００２２】

「化合物（Ｉ）」、「化合物（Ｉ’’）」または「化合物（Ｉ’’’）」という場合には、各々の化合物の生成可能であり、製薬上許容される塩も包含する。「製薬上許容される塩」としては、例えば塩酸、硫酸、硝酸、リン酸、フッ化水素酸、臭化水素酸等の鉱酸の塩；ギ酸、酢酸、酒石酸、乳酸、クエン酸、フマール酸、マレイン酸、コハク酸等の有機酸の塩；アンモニウム、トリメチルアンモニウム、トリエチルアンモニウム等の有機塩基の塩；ナトリウム、カリウム等のアルカリ金属の塩またはカルシウム、マグネシウム等のアルカリ土類金属の塩等を挙げることができる。

本発明に係る化合物はその水和物も包含し、化合物（Ｉ）または（Ｉ’’）は水分子と結合していてもよい。また、本発明に係る化合物はアトロプ異性体をも包含している。

本明細書中において、「化合物（Ｉ）」とは化合物（Ｉ’）を除いた新規化合物群であり、「化合物（Ｉ’’）」とは化合物（Ｉ）および公知化合物を含む化合物群であり、「化合物（Ｉ’’’）」とは化合物（Ｉ）および化合物（Ｉ’）を含む化合物群である。

化合物（Ｉ）および（Ｉ’’）は全て免疫抑制作用および／または抗アレルギー作用を有しているが、その中でも特に以下の化合物が好ましい。

【００２３】

式（Ｉ）および（Ｉ’’）において、

１）$R^1$、$R^2$、$R^3$、$R^4$、$R^5$、$R^6$、$R^7$、$R^8$、$R^9$、$R^{10}$、$R^{11}$、$R^{12}$および$R^{13}$は各々独立して、水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミル、置換基を有していてもよいアミノまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり

Xは－O－、－$CH_2$－、－$NR^{14}$－（ここで$R^{14}$は水素または置換基を有していてもよい低級アルキル）または－SOp－（ここでpは0～2の整数）であり、

Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシルまたは置換基を有していてもよいシクロアルケニルであり、また$R^1$および$R^4$、$R^1$および$R^2$、$R^{11}$、XおよびYまたは$R^{13}$、XおよびYは一緒になってOを1以上含んでいてもよく、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい化合物、

【0024】

2）$R^1$が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいアミノであり、$R^2$が水素、ヒドロキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシであり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$および$R^8$が各々独立して水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$が水素、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいカルバモイルであり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$が水素、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルであり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置

換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルであり、Yは置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニルまたは置換基を有していてもよいシクロアルケニルであり、$R^1$および$R^2$、$R^1$および$R^4$、$R^{11}$、XおよびYまたは$R^{13}$、XおよびYは一緒になって、Oを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成してもよい化合物、

【0025】

3）$R^1$が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルチオ、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置換基を有していてもよいアミノである（以下、$R^1$がR1－1であると略記する）か、または$R^2$もしくは$R^4$と一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

好ましくは$R^1$が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニルオキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシである（以下、$R^1$がR1－2であると略記する）か、または$R^2$もしくは$R^4$と一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

さらに好ましくは$R^1$が水素、ヒドロキシ、ハロゲン、低級アルキルオキシ低級アルキルオキシ、アリール低級アルキルオキシ、低級アルケニルオキシ、低級アルキルスルホニルオキシである（以下$R^1$がR1－3であると略記する）か、または$R^2$もしくは$R^4$と一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

特に好ましくは$R^1$が水素、ヒドロキシ、フッ素、メチルオキシメチルオキシ、ベンジルオキシ、3－メチル－2－ブテニルオキシ、メタンスルホニルオキシである（以下$R^1$がR1－4であると略記する）か、または$R^2$もしくは$R^4$と一緒

になって－$OCH_2O$－を形成する化合物、

【0026】

4）$R^2$が水素、ヒドロキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシである（以下、$R^2$がR2－1であると略記する）か、または$R^1$と一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

好ましくは$R^2$が水素、ヒドロキシまたは低級アルキルスルホニルオキシである（以下、$R^2$がR2－2であると略記する）化合物

5）$R^3$が水素である化合物、

6）$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであるか、または$R^1$と一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

好ましくは$R^4$が水素であるか、または$R^1$と一緒になって－$OCH_2O$－を形成する化合物、

7）$R^5$が水素である化合物、

【0027】

8）$R^6$が水素またはハロゲンである化合物、

好ましくは$R^6$が水素またはフッ素である化合物、

9）$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシである化合物、

好ましくは$R^7$が水素または低級アルキルオキシである化合物、

10）$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシである化合物、

好ましくは$R^8$が水素または低級アルキルオキシである化合物、

【0028】

11）$R^9$が水素、ヒドロキシ、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、ホルミルまたは置

換基を有していてもよいカルバモイルである（以下、$R^9$がＲ９－１であると略記する）化合物、

好ましくは$R^9$が水素、ヒドロキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシ、置換基を有していてもよいカルバモイル、カルボキシまたは置換基を有していてもよい低級アルキルオキシカルボニルである（以下、$R^9$がＲ９－２であると略記する）化合物、

さらに好ましくは$R^9$が水素、ヒドロキシ、ヒドロキシ低級アルキル、低級アルキルオキシカルボニル低級アルケニル、低級アルキルオキシ低級アルキルオキシ、低級アルキルスルホニルオキシ、ジ低級アルキルカルバモイル、カルボキシまたは低級アルキルオキシカルボニルである（以下、$R^9$がＲ９－３であると略記する）化合物、

特に好ましくは$R^9$が水素、ヒドロキシ、ヒドロキシメチル、エチルオキシカルボニルビニル、メチルオキシメチルオキシ、メタンスルホニル、ジメチルカルバモイル、カルボキシまたはメチルオキシカルボニルである（以下、$R^9$がＲ９－４であると略記する）化合物、

【００２９】

１２）$R^{10}$が水素である化合物、

１３）$R^{11}$が水素、ハロゲン、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルである（以下、$R^{11}$がＲ１１－１であると略記する）か、またはＸおよびＹと一緒になってＯを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、

好ましくは$R^{11}$が水素またはハロゲンである（以下、$R^{11}$がＲ１１－２であると略記する）化合物、

１４）$R^{12}$が水素である化合物、

【００３０】

１５）$R^{13}$がヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有してい

てもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルである（以下、$R^{13}$がＲ１３－１であると略記する）か、またはＸおよびＹと一緒になってＯを１以上含み、置換基（低級アルケニル、ハロゲン化低級アルケニル等）を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、
好ましくは$R^{13}$がヒドロキシ、ハロゲン、カルボキシ、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルキルオキシ、置換基を有していてもよいアシルオキシ、置換基を有していてもよい低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルである（以下、$R^{13}$がＲ１３－２であると略記する）化合物、
さらに好ましくは$R^{13}$がヒドロキシ、ハロゲン、置換基（ヒドロキシ、ハロゲン）を有していてもよい低級アルキル、置換基（低級アルキルオキシカルボニル、低級アルキルオキシ）を有していてもよい低級アルキルオキシ、ハロゲン化低級アルケニルオキシ、アロイルオキシ、低級アルキルスルホニルオキシまたはホルミルである（以下、$R^{13}$がＲ１３－３であると略記する）化合物、
特に好ましくは$R^{13}$がヒドロキシ、フッ素、メチル、ヒドロキシメチル、ヨウ化メチル、エチルオキシカルボニルメチルオキシ、メチルオキシメチルオキシ、クロロブテニルオキシ、ブロムプロペニルオキシ、クロロプロペニルオキシ、ブロムブテニルオキシ、ジクロロプロペニルオキシ、エチルオキシカルボニル、ベンゾイルオキシ、メタンスルホニルオキシ、ホルミルである（以下、$R^{13}$がＲ１３－４であると略記する）化合物、

【００３１】

１６）Ｘが－Ｏ－、$-CH_2-$または－ＳＯｐ－（ここでｐは０～２の整数）である（以下、ＸがＸ１であると略記する）か、または$R^{13}$およびＹと一緒になってＯを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、
好ましくはＸが－Ｏ－、$-CH_2-$または－ＳＯｐ－（ここでｐは０～２の整数）でである化合物（以下、ＸがＸ２であると略記する）、

【００３２】

１７）Ｙが置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニルまたは置換基を有し

ていてもよいシクロアルケニルである（以下、YがY１であると略記する）か、$R^{13}$およびXと一緒になってOを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、

好ましくは、Yが置換基（ヒドロキシ、低級アルキルオキシカルボニル、アシル、シクロアルキル、シクロアルケニル、ヒドロキシイミノ、低級アルキルオキシイミノ、カルボキシ低級アルキルオキシイミノ、アリール低級アルキルオキシイミノ、ヘテロ環イミノアリール、低級アルキルアリール、ハロゲン化アリール、低級アルキルオキシアリール、カルボキシアリール、低級アルキルオキシカルボニルアリールもしくはヘテロ環）を有していてもよい低級アルキル、置換基（ハロゲン、シクロアルキル、低級アルキルオキシカルボニルもしくはアリールヘテロ環）を有していてもよい低級アルケニル、ハロゲンを有していてもよい低級アルキニル、シクロアルケニルまたはアシルである（以下、YがY２であると略記する）化合物、

特に好ましくはYがイソプロピル、エチルオキシカルボニルメチル、ベンジル、メチルフェニルメチル、フルオロフェニルメチル、ジクロロフェニルメチル、メトキシフェニルメチル、ピリジニルメチル、ベンゾイルメチル、プロペニル、メチルプロペニル、メチルブテニル、ペンテニル、メチルペンテニル、ジメチルオクタジエニル、クロロプロペニル、ジクロロプロペニル、ブロムプロペニル、ブロムブテニル、クロロブテニル、フェニルプロペニル、プロピニル、ブチニル、クロロブチニル、シクロヘキセニル、ジメチルオキシランメチルである（以下、YがY３であると略記する）化合物、

【００３３】

１８）$R^1$がR１－２であり、$R^2$がR２－１であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がR９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がR１１－１であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がR１３－１であり、XがX１であり、YがY１であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、XおよびYが一緒

になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

19）$R^1$がR1－2であり、$R^2$がR2－1であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がR9－1であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がR11－1であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がR13－2であり、XがX1であり、YがY1であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、XおよびYが一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

【0034】

20）$R^1$がR1－2であり、$R^2$がR2－1であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がR9－1であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がR11－1であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がR13－1であり、XがX1であり、YがY2であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、XおよびYが一緒になってOを1以上含み、置換基を有していてもよい5～6員環を形成する化合物、

【0035】

21）$R^1$がR1－1であり、$R^2$がR2－1であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がR9－2であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がR11－1であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がR13－2であり、XがX1であり、YがY1であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、XおよびYが一緒

になってOを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、

２２）$R^1$がＲ１－１であり、$R^2$がＲ２－１であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－１であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－１であり、ＸがＸ１であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、ＸおよびＹが一緒になってOを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、

【００３６】

２３）$R^1$がＲ１－１であり、$R^2$がＲ２－１であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－１であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－１であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ１であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、ＸおよびＹが一緒になってOを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、

【００３７】

２４）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－１であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－１であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ１であり、ＹがＹ１であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、ＸおよびＹが一緒

になってOを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、

２５）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－１であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－１であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－１であり、ＸがＸ１であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、ＸおよびＹが一緒になってOを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、

【００３８】

２６）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－１であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－１であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－１であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ１であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、ＸおよびＹが一緒になってOを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合物、

２７）$R^1$がＲ１－１であり、$R^2$がＲ２－１であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルであり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはハロゲンであり、$R^7$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－１であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ１であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^2$もしくは$R^4$、並びに$R^{13}$、ＸおよびＹが一緒になってOを１以上含み、置換基を有していてもよい５～６員環を形成する化合

物、

【００３９】

２８）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になってＯを１以上含む５～６員環を形成する化合物、

２９）$R^1$がＲ１－３であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になってＯを１以上含む５～６員環を形成する化合物、

【００４０】

３０）$R^1$がＲ１－４であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になって－ＯＣ$H_2$Ｏ－を形成する化合物、

３１）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－３であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になってＯを１以上含む５～６員環を形成する化合物、

【００４１】

３２）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または

低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－４であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になってＯを１以上含む５～６員環を形成する化合物、

３３）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－３であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になってＯを１以上含む５～６員環を形成する化合物、

【００４２】

３４）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－４であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になってＯを１以上含む５～６員環を形成する化合物、

３５）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ３であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になってＯを１以上含む５～６員環を形成する化合物、

【００４３】

３６）$R^1$がＲ１－３であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－３であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$

およびR$^4$が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

37）R$^1$がR1－3であり、R$^2$がR2－2であり、R$^3$が水素であり、R$^4$が水素であり、R$^5$が水素であり、R$^6$が水素またはフッ素であり、R$^7$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^8$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^9$がR9－2であり、R$^{10}$が水素であり、R$^{11}$がR11－2であり、R$^{12}$が水素であり、R$^{13}$がR13－3であり、XがX2であり、YがY2であるか、またはR$^1$およびR$^4$が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

【0044】

38）R$^1$がR1－3であり、R$^2$がR2－2であり、R$^3$が水素であり、R$^4$が水素であり、R$^5$が水素であり、R$^6$が水素またはフッ素であり、R$^7$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^8$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^9$がR9－2であり、R$^{10}$が水素であり、R$^{11}$がR11－2であり、R$^{12}$が水素であり、R$^{13}$がR13－2であり、XがX2であり、YがY3であるか、またはR$^1$およびR$^4$が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

39）R$^1$がR1－2であり、R$^2$がR2－2であり、R$^3$が水素であり、R$^4$が水素であり、R$^5$が水素であり、R$^6$が水素またはフッ素であり、R$^7$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^8$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^9$がR9－3であり、R$^{10}$が水素であり、R$^{11}$がR11－2であり、R$^{12}$が水素であり、R$^{13}$がR13－3であり、XがX2であり、YがY2であるか、またはR$^1$およびR$^4$が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

【0045】

40）R$^1$がR1－2であり、R$^2$がR2－2であり、R$^3$が水素であり、R$^4$が水素であり、R$^5$が水素であり、R$^6$が水素またはフッ素であり、R$^7$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^8$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^9$がR9－3であり、R$^{10}$が水素であり、R$^{11}$がR11－2であり、R$^{12}$が水素であり、R$^{13}$がR13－2であり、XがX2であり、YがY3であるか、またはR$^1$およびR$^4$が一緒になってOを1以上含む5～6員環を形成する化合物、

41）R$^1$がR1－2であり、R$^2$がR2－2であり、R$^3$が水素であり、R$^4$が水素であり、R$^5$が水素であり、R$^6$が水素またはフッ素であり、R$^7$が水素または

低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－３であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ３であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になってＯを１以上含む５～６員環を形成する化合物、

【００４６】

４２）$R^1$がＲ１－３であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－３であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－３であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ２であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になって－ＯＣ$H_2$Ｏ－を形成する化合物、

４３）$R^1$がＲ１－３であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－３であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－２であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ３であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になって－ＯＣ$H_2$Ｏ－を形成する化合物、

【００４７】

４４）$R^1$がＲ１－３であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－２であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－３であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ３であるか、または$R^1$および$R^4$が一緒になって－ＯＣ$H_2$Ｏ－を形成する化合物、

４５）$R^1$がＲ１－２であり、$R^2$がＲ２－２であり、$R^3$が水素であり、$R^4$が水素であり、$R^5$が水素であり、$R^6$が水素またはフッ素であり、$R^7$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^8$が水素または低級アルキルオキシであり、$R^9$がＲ９－３であり、$R^{10}$が水素であり、$R^{11}$がＲ１１－２であり、$R^{12}$が水素であり、$R^{13}$がＲ１３－３であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ３であるか、または$R^1$

およびR$^4$が一緒になってOを１以上含む５～６員環を形成する化合物、

【００４８】

４６）R$^1$がＲ１－３であり、R$^2$がＲ２－２であり、R$^3$が水素であり、R$^4$が水素であり、R$^5$が水素であり、R$^6$が水素またはフッ素であり、R$^7$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^8$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^9$がＲ９－３であり、R$^{10}$が水素であり、R$^{11}$がＲ１１－２であり、R$^{12}$が水素であり、R$^{13}$がＲ１３－３であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ３であか、またはR$^1$およびR$^4$が一緒になって－ＯＣ$H_2$Ｏ－を形成する化合物、または

４７）R$^1$がＲ１－４であり、R$^2$がＲ２－２であり、R$^3$が水素であり、R$^4$が水素であり、R$^5$が水素であり、R$^6$が水素またはフッ素であり、R$^7$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^8$が水素または低級アルキルオキシであり、R$^9$がＲ９－４であり、R$^{10}$が水素であり、R$^{11}$がＲ１１－２であり、R$^{12}$が水素であり、R$^{13}$がＲ１３－４であり、ＸがＸ２であり、ＹがＹ３であか、またはR$^1$およびR$^4$が一緒になって－ＯＣ$H_2$Ｏ－を形成する化合物。

【００４９】

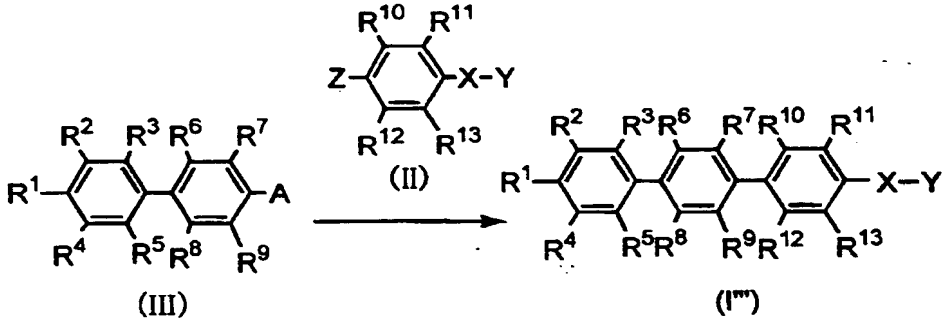
以下に化合物（Ｉ’’’）の製造方法を説明する。

化合物（Ｉ’’’）の製造方法

化合物（Ｉ’’’）は、下記に示すごとく、一般式（ＩＩ）または（ＩＩ’）で示されるボラン化合物と一般式（III）または（III’）で示されるビフェニル誘導体とを反応させることにより製造し得る。

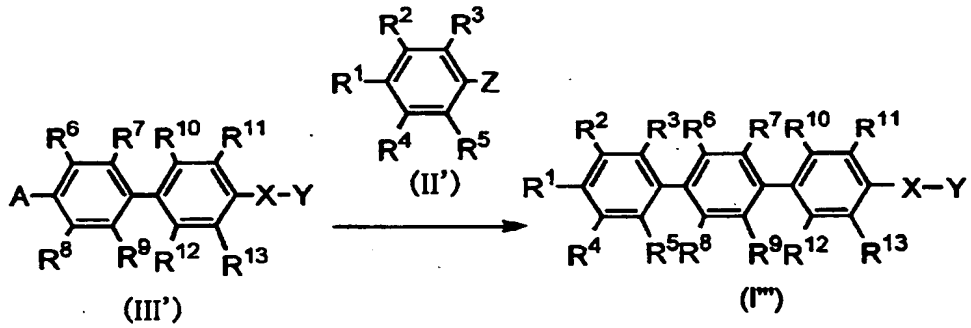
【００５０】

【化２１】




または

【化２２】



(III')　(II')　(I''')

（式中、$R^1$～$R^{13}$、ＸおよびＹは前記式（Ｉ'''）における場合と同義であり、Ｚは前記式（ＩＩ）における場合と同義であり、Ａは前記式（III）における場合と同義）

【００５１】

化合物（ＩＩ）および化合物（III）または化合物（ＩＩ'）および化合物（III'）を適当な溶媒（例えばベンゼン、トルエン、ジメチルホルムアミド、ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エタノール、メタノール等）と水との混合系または無水系でパラジウム触媒（例えば$Pd(PPh_3)_4$、$PdCl_2(PPh_3)_2$、$PdCl_2(OAc)_2$、$PdCl_2(CH_3CN)_2$等）の存在下、塩基性条件（$K_3PO_4$、$NaHCO_3$、ＮａＯＥｔ、$Na_2CO_3$、$Et_4NCl$、$Ba(OH)_2$、$Cs_2CO_3$、ＣｓＦ、ＮａＯＨ、$Ag_2CO_3$等）で室温～加熱下、数分～数十時間反応させて化合物（Ｉ）を得る。

【００５２】

化合物（III）および（III'）における置換基Ａは、鈴木反応（ケミカル・コミュニケーション（Ｃｈｅｍｉｃａｌ　Ｃｏｍｍｕｎｉｃａｔｉｏｎ）１９７９，８６６、有機合成化学協会誌、１９９３年、第５１巻、第１１号、第９１頁～第１００頁）に適用可能な脱離基であればいずれでもよく、例えばハロゲンまたは$-OSO_2(C_qF_{2q+1})$（ここでｑは０～４の整数）等を用いることができる。特にハロゲンまたはトリフルオロメタンスルホニルオキシ（以下ＯＴｆとする）等が好ましく、最も好ましくは臭素、ヨウ素またはＯＴｆである。

化合物（ＩＩ）および（III'）の置換基Ｙは、鈴木反応に影響を与えない基、例えばハロゲン、$-OSO_2(C_qF_{2q+1})$（ここでｑは０～４の整数）以外の

基であればいずれでもよい。具体的には、置換基を有していてもよい低級アルキル、置換基を有していてもよい低級アルケニル、置換基を有していてもよい低級アルキニル、置換基を有していてもよいアシル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいアリールまたは置換基を有していてもよいヘテロ環であり、Xが－$CH_2$－である場合には置換基を有していてもよい低級アルキルオキシであってもよい。

【００５３】

ただし、Ｙがハロゲンであっても、化合物（ＩＩ）または（ＩＩ’）のボロン化合物と反応する置換基Ａの方が、より反応性が高い場合であれば本反応は支障なく進めることが可能である。また、Ｙが水素であっても上記反応は可能であるが、その場合には好ましくは通常用いられるヒドロキシ保護基（例えばメトキシメチル、ベンジル、ｔ－ブチルジメチルシリル、メタンスルホニル、ｐ－トルエンスルホニル等）で保護した後、上記反応に付し、その後で通常の脱保護反応を行う。

【００５４】

上記化合物中、置換基$R^1$～$R^{13}$は、この反応に影響を与えない基（例えばハロゲン、－$OSO_2$（$C_qF_{2q+1}$）（ここでｑは０～４の整数）以外の基）であるか、あるいはこの反応に影響を与えない基であって、通常用いられる反応により$R^1$～$R^{13}$に変換可能な基であればよい。この場合には、各化合物の反応に応じて適当な段階で$R^1$～$R^{13}$に変換すればよい。

例えば、いずれかの置換基がホルミルであり、目的とする置換基がヒドロキシである場合には、例えばバイヤービリガー（Ｂａｅｙｅｒ－Ｖｉｌｌｉｇｅｒ）反応等を用い、一旦ホルミルオキシ基とした後、酸性条件下またはアルカリ性条件下で通常の加水分解反応を行えばよい。具体的には、化合物を適当な溶媒（例えば１，２－ジクロロエタン、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、ベンゼン）中、過酸（例えば過酢酸、過安息香酸、メタクロロ過安息香酸、トリフルオロ過酢酸、過酸化水素）と－２０℃～加熱下、数分～数十時間反応させ、得られたホルミルオキシ基を酸性条件下（例えば塩酸と加熱）または塩基性条件下

（例えば水酸化ナトリウム水溶液と加熱）で加水分解すればよい。

【００５５】

また、いずれかの置換基がホルミルであり、目的とする置換基がヒドロキシメチルである場合には、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素亜鉛、水素化ホウ素トリエチルリチウム、水素化アルミニウム、ジイソブチル水素化アルミニウム等の還元剤を用い、還元剤に応じた適当な溶媒（例えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ジメチルスルホキシド、ジエチレングリコールジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ベンゼン、トルエン、シクロヘキサン等）中、－２０℃～８０℃、好ましくは氷冷下～室温で数時間反応させればよい。

さらに、いずれかの置換基がホルミルであり、目的とする置換基が炭素数の増加したアルケニルである場合には、ウィッティッヒ（Ｗｉｔｔｉｇ）反応（オーガニック・リアクション（Ｏｒｇａｎｉｃ　Ｒｅａｃｔｉｏｎ）、１９６５年、第１４巻、第２７０頁）により目的化合物が得られる。

【００５６】

いずれかの置換基がホルミルであり、目的とする置換基がカルボキシである場合には、亜塩素酸ナトリウム、ジョーンズ試薬、無水クロム酸等の酸化剤を用い、酸化剤に応じてｔ－ブタノール、アセトン等の溶媒中、０℃～加熱下で数時間反応させればよい。必要であれば２－メチル－２－ブテン、リン酸二水素ナトリウム等を添加すれば好適に反応を進めることができる。

また、いずれかの置換基がヒドロキシであって、目的とする置換基が置換低級アルキルオキシである場合には、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化カルシウム、水酸化バリウムおよび炭酸カルシウム等の塩基存在下、適当な溶媒（例えばテトラヒドロフラン、アセトン、ジメチルホルムアミド、アセトニトリル等）中で対応するアルキル化剤を反応させればよいが、具体的には、ヨウ化酢酸メチル、塩化酢酸エチル、塩化酢酸プロピル等の目的に応じたハロゲン化化合物と反応させることによって置換基がアルキルオキシカルボニル低級アルキルオキシである化合物を得ることができる。

【００５７】

いずれかの置換基がカルボキシであり、目的とする置換基がカルバモイルである場合には、適当な溶媒（例えばテトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジエチルエーテル、ジクロロメタン等）中、必要であれば適当な活性化剤（例えば塩化チオニル、酸ハロゲン化物、酸無水物、活性化エステル等）で活性化し、アンモニア、ジメチルアミン等のアミン化合物と０℃～加熱下、数分～数時間反応させてカルバモイル化すればよい。

いずれかの置換基が水素であり、目的とする置換基がハロゲンである場合、適当な溶媒（例えばクロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、アセトニトリル、ニトロメタン、酢酸、無水酢酸等）中、必要であればルイス酸、塩酸、リン酸等の触媒存在下、通常用いられるハロゲン化剤（例えば臭素、塩素、ヨウ素、塩化スルフリル、Ｎ－ブロモこはく酸イミド、Ｎ－ヨードこはく酸イミド等）と－２０℃～加熱下、数分～数十時間反応させてハロゲン化すればよい。

【００５８】

化合物（Ｉ）を得る場合、上記の様に置換基－Ｘ－Ｙを有する化合物（ＩＩ）と化合物（III）、または置換基－Ｘ－Ｙを有する化合物（III’）と化合物（ＩＩ’）を直接反応させてもよいが、置換基－Ｘ－Ｙに変換し得る置換基－Ｗを有する化合物を化合物（III）または（ＩＩ’）と反応させ、最後に置換基を－Ｘ－Ｙに変換してもよい。

例えば、－Ｗがヒドロキシまたは保護されたヒドロキシである化合物には、通常用いられる反応により、目的とする低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、アシル、シクロアルキル、シクロアルケニル、アリール、ヘテロ環または低級アルキルオキシ等を導入すればよい。

【００５９】

具体的には、Ｘが－Ｏ－である化合物を得る場合、まず－Ｗがヒドロキシである化合物を得、これを適当な溶媒（例えばジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、アセトン、ベンゼン、ジオキサン、アセトニトリル等）に溶解し、これにアルカリ金属もしくはアルカリ土類金属の水酸化物もしくは炭酸塩（例えば炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸カリウム、水酸化カルシウム、水酸化

バリウムおよび炭酸カルシウム等）または三級アミン（例えばトリエチルアミン等）等の塩基性助剤を加える。ここにY－V（Vはハロゲンまたは－OSO$_2$（C$_q$F$_{2q+1}$）（ここでqは0～4の整数）である）で示される化合物（例えば、プレニルブロミド、シクロヘキセニルブロミド、シンナミルブロミド、1－ブロモ－2－ペンテン、ゲラニルブロミド、5－ブロモ－2－メチル－2－ペンテン、1，3－ジクロロ－2－ブテン、3－クロロプロピン、プレニルトリフレート、シクロヘキセニルトリフレート等）を加え、－20℃～加熱下、数分～数十時間反応させれば、－Wが－O－Yに置換された目的合物が得られる。

【0060】

また、Xが－CH$_2$－、－NR$^{14}$－または－S－である化合物を得る場合、まず－Wがヒドロキシである化合物を無水塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等の溶媒中、ピリジン、トリエチルアミン等の塩基存在下、無水トリフルオロメタンスルホン酸等と反応させてトリフレート化した後、パラジウム、ニッケル等の触媒存在下、適当な溶媒（例えばテトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジエチルエーテル、ジメトキシエタン等）中でY－V'（V'は－CH$_2$ZnI、－SH、－NHR$^{14}$）を反応させて目的化合物を得る事が可能である。

Xが－SO－または－SO$_2$－である化合物を得る場合には、まず上記の方法によりXが－S－である化合物を得、m－クロロ安息香酸等の通常の酸化剤を用いて酸化して目的化合物を得ることができる。

【0061】

本発明に係る化合物の1つである－X－Yが低級アルケニルオキシである化合物を、さらにエタノール、酢酸エチル等の溶媒に溶解し、Pd－カーボン粉末、白金、ロジウム、ルテニウム、ニッケル等の触媒を用いて水素添加すれば－X－Yが低級アルキルオキシである化合物が得られる。

また、－X－Yが低級アルケニルオキシである化合物をジクロロメタン、クロロホルム、ベンゼン、ヘキサンt－ブタノール等の溶媒中、メタクロロ過安息香酸等と反応させれば－X－Yがエポキシ化低級アルキルオキシである化合物に変換することができる。

【００６２】

尚、反応を実施する際に支障となる置換基（例えばヒドロキシ等）を有する化合物については、その基をあらかじめメチルオキシメチル、メタンスルホニル、ベンジル、トリフルオロメタンスルホニル、ｔ－ブチルジメチルシリル等の保護基で保護しておき、適当な段階で適当な保護基を脱離させればよい。

例えばメタンスルホニルでヒドロキシを保護する場合、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等の溶媒中、トリエチルアミン、ピリジン等の塩基存在下で塩化メタンスルホニルを氷冷下～室温で数時間反応させればよい。脱保護反応に付す場合にはジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン等の溶媒中、１～４Ｎの水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、それらの水溶液、ナトリウムメトキシドまたはエチルマグネシウムブロミド等を加え、室温～加熱下で数十分～数時間反応させればよい。

【００６３】

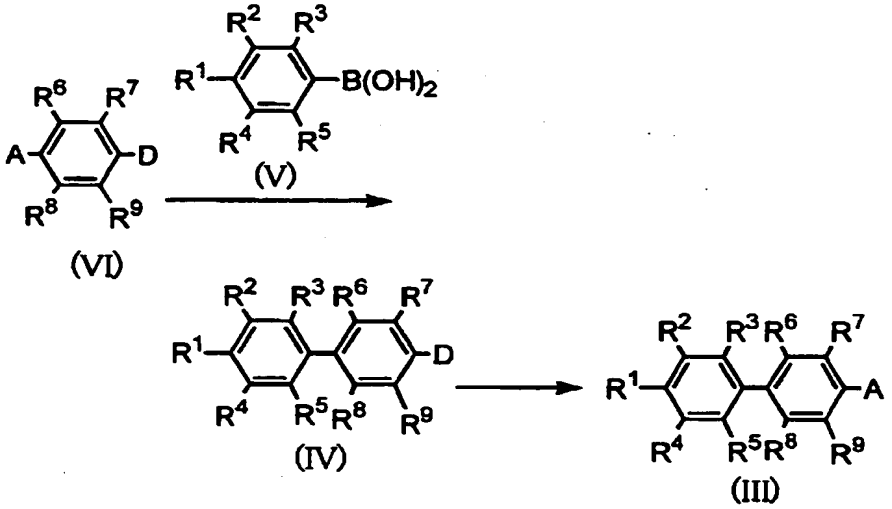
メチルオキシメチルをヒドロキシの保護基とする場合には、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン等の溶媒中で水素化ナトリウム、ジイソプロピルエチルアミン等の存在下でクロロメチルメチルエーテルと反応させれば保護されたヒドロキシを得ることができる。脱保護する場合にはメタノール、テトラヒドロフラン、酢酸等の溶媒中で塩酸、硫酸等を用いて通常の脱保護反応を行えばよい。

ｔ－ブチルジメチルシリルを保護基とする場合には、ジメチルホルムアミド、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン等の溶媒中、イミダゾール、トリエチルアミン、２、６－ルチジン等の存在下で塩化ｔ－ブチルジメチルシリル、ｔ－ブチルジメチルシリルトリフルオレート等と反応させればよい。脱保護反応はテトラヒドロフラン等の溶媒中でテトラブチルフッ化アンモニウム等と反応させれば保護基の脱離が可能である。

【００６４】

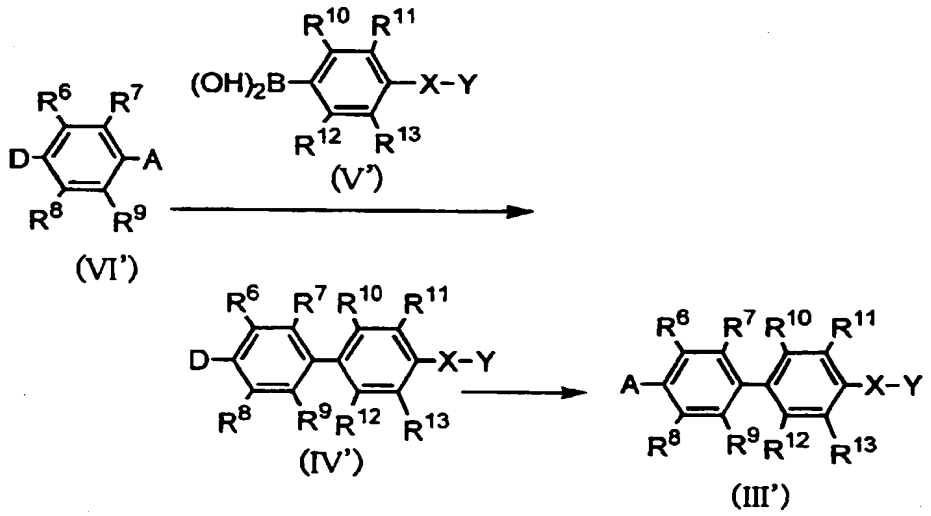
上記スキーム中の化合物（III）および（III’）は公知の化合物を用いてもよく、また、以下のような方法により合成したものを用いてもよい。

【化２３】



または

【化２４】



【００６５】

まず、上記の工程と同様に公知の化合物（Ｖ）および化合物（ＶＩ）、または化合物（Ｖ’）および化合物（ＶＩ’）（Ａ＝鈴木反応に適用可能な基；例えばハロゲンまたは－ＯＳＯ$_2$（$C_qF_{2q+1}$）（ここでｑは０～４の整数）、Ｄ＝ハロゲンおよび－ＯＳＯ$_2$（$C_qF_{2q+1}$）（ここでｑは前記と同義）以外の基）を反応させ、化合物（ＩＶ）または化合物（ＩＶ’）を得る。

次に、置換基Ｄを鈴木反応に適用可能な置換基Ａに変換する。

例えば、D＝水素である場合、適当な溶媒（例えば酢酸、クロロホルム、ジクロロメタン、四塩化炭素、水、酢酸－酢酸ソーダ等）中、ハロゲン化剤（例えば臭素、塩素、ヨウ素、スルフリルクロリド、N－ブロモこはく酸イミド等）と－２０℃～加熱下、数分～数十時間反応させればA＝ハロゲンである目的化合物が得られる。

【００６６】

また、Dが保護されたヒドロキシである場合は、適当な溶媒（例えばジクロロメタン、クロロホルム、テトラヒドロフラン、ベンゼン）中、塩基（例えばピリジン、トリエチルアミン）の存在下、トリフルオロメタンスルホニル化剤（例えば無水トリフルオロメタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホニルクロリド等）と－２０℃～加熱下で数分～数十時間反応させてA＝ＯＴｆである目的化合物が得られる。

【００６７】

本発明に係る化合物はマイトジェン反応および／またはサイトカイン反応を抑制し、強い免疫抑制作用および抗アレルギー作用を示す。具体的には、T、B両細胞に対する非常に強い増殖抑制作用、ＩＬ－２、ＩＬ－４、およびＩＬ－５等のサイトカイン産生抑制作用、および／またはＩｇＥ、ＩｇＧ等の抗体産生抑制作用を有している。従って、医薬としてヒトを含む動物の免疫抑制または抗アレルギーのために投与することができる。

免疫抑制剤または抗アレルギー剤としての本発明に係る化合物は、臓器または組織移植に対する拒絶反応および骨髄移植によって起こる移植片対宿主反応、並びに慢性関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、喘息、炎症性大腸炎、虚血再潅流における傷害、アレルギー性鼻炎、アレルギー性結膜炎、アトピー、蕁麻疹および乾癬等のアレルギー性疾患の予防または治療に有用である。

【００６８】

本発明に係る化合物を免疫抑制剤および／または抗アレルギー剤として投与する場合、経口的、非経口的のいずれの方法でも投与することができる。経口投与は常法に従って錠剤、顆粒剤、散剤、カプセル剤、丸剤、液剤、シロップ剤、バッカル剤または舌下剤等の通常用いられる剤型に調製して投与すればよい。非経

口投与は、例えば筋肉内投与、静脈内投与等の注射剤、坐剤、経皮吸収剤、吸入剤等、通常用いられるいずれの剤型でも好適に投与することができる。特に経口投与が好ましい。

【００６９】

本発明に係る化合物の有効量にその剤型に適した賦形剤、結合剤、湿潤剤、崩壊剤、滑沢剤、希釈剤等の各種医薬用添加剤とを必要に応じて混合し医薬製剤とすることができる。注射剤の場合には適当な担体と共に滅菌処理を行なって製剤とすればよい。

具体的には、賦形剤としては乳糖、白糖、ブドウ糖、デンプン、炭酸カルシウムもしくは結晶セルロース等、結合剤としてはメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ゼラチンもしくはポリビニルピロリドン等、崩壊剤としてはカルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、デンプン、アルギン酸ナトリウム、カンテン末もしくはラウリル硫酸ナトリウム等、滑沢剤としてはタルク、ステアリン酸マグネシウムもしくはマクロゴール等が挙げられる。坐剤の基剤としてはカカオ脂、マクロゴールもしくはメチルセルロース等を用いることができる。また、液剤もしくは乳濁性、懸濁性の注射剤として調製する場合には通常使用されている溶解補助剤、懸濁化剤、乳化剤、安定化剤、保存剤、等張剤等を適宜添加しても良く、経口投与の場合には矯味剤、芳香剤等を加えても良い。

【００７０】

本発明に係る化合物の免疫抑制剤および／または抗アレルギー剤としての投与量は、患者の年齢、体重、疾病の種類や程度、投与経路等を考慮した上で設定することが望ましいが、成人に経口投与する場合、通常０．０５～１００ｍｇ／ｋｇ／日であり、好ましくは０．１～１０ｍｇ／ｋｇ／日の範囲内である。非経口投与の場合には投与経路により大きく異なるが、通常０．００５～１０ｍｇ／ｋｇ／日であり、好ましくは０．０１～１ｍｇ／ｋｇ／日の範囲内である。これを１日１回～数回に分けて投与すれば良い。

【００７１】

以下に実施例を示し、本発明をさらに詳しく説明するが、これらは本発明を限

定するものではない。

【実施例】

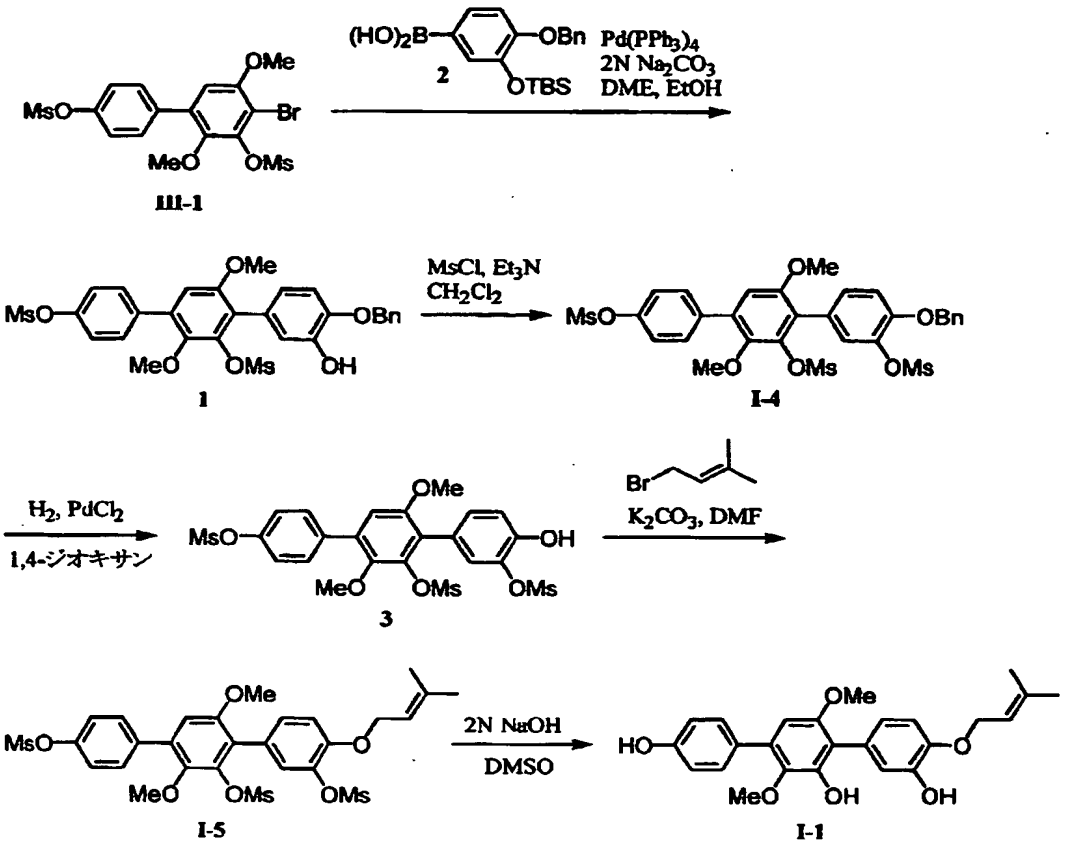
実施例中に用いる略語の意味は以下の通りである。

| | |
|---|---|
| Ｂｎ | ベンジル |
| ＤＭＥ | １，２－ジメトキシエタン |
| ＤＭＦ | Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド |
| ＤＭＳＯ | ジメチルスルホキシド |
| ＭＣＰＢＡ | ｍ－クロロ過安息香酸 |
| ＭＯＭ | メチルオキシメチル |
| Ｍｓ | メタンスルホニル |
| Ｐｙ | ピリジン |
| ＴＢＳ | ｔ－ブチルジメチルシリル |
| Ｔｆ | トリフルオロメタンスルホニル |

【００７２】

実施例１　化合物（Ｉ－１）、（Ｉ－２）、（Ｉ－３）の合成

【化２５】




【００７３】

（第１工程）化合物１の合成

化合物（III－１）１０．６３ｇ（２２．０８ｍｍｏｌ）の１，２－ジメトキシエタン溶液３００ｍｌに、室温でテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）３．６０ｇ（３．１２ｍｍｏｌ）を加えた。そこへ、化合物２（９．５０ｇ；２６．５ｍｍｏｌ）の９９％エタノール溶液８０ｍｌ、２M炭酸ナトリウム水溶液１２５ｍｌ（２５０ｍｍｏｌ）を加え、この反応懸濁液をアルゴン雰囲気下で、６時間加熱還流した。冷却後、反応混合物をろ過して不溶物を除去し、ろ液を２N塩酸で酸性にした後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、５％炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン－酢酸エチル１：１）で精製後、ヘキサン－酢酸エチルより再結晶を行い、化合物１（１１．５７ｇ；収率８７％）を無

色結晶として得た。

【００７４】

（第２工程）化合物（Ｉ－２）の合成

化合物１（９．３０ｇ；１５．４８ｍｍｏｌ）の無水塩化メチレン懸濁液６０ｍｌに、氷冷下でトリエチルアミン３．２４ｍｌ（２３．２２ｍｍｏｌ）、続いてメタンスルホニルクロリド１．８０ｍｌ（２３．２２ｍｍｏｌ）を加え、同温度で２時間撹拌した。溶媒を留去した後、１N塩酸８０ｍｌで溶液を酸性にし、クロロホルムで抽出した。抽出液を順次、１N塩酸、５％炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン－酢酸エチルから再結晶し、化合物（Ｉ－２）９．９３ｇ（収率９５％）を無色結晶として得た。

（第３工程）化合物３の合成

化合物（Ｉ－２）９．７６ｇ（１４．３８ｍｍｏｌ）と塩化パラジウム（II）７６５ｍｇ（４．３１ｍｍｏｌ）の１，４－ジオキサン溶液３００ｍｌを水素雰囲気下、室温で１５時間撹拌した。不溶物をセライトろ過で除去し、ろ液を濃縮した後、残渣をヘキサン－酢酸エチルから再結晶して化合物３（８．４３ｇ；収率１００％）を無色結晶として得た。

【００７５】

（第４工程）化合物（Ｉ－３）の合成

化合物３（４．０１ｇ；６．８１ｍｍｏｌ）の無水N，N－ジメチルホルムアミド溶液４０ｍｌに、炭酸カリウム１．４５ｇ（１０．５ｍｍｏｌ）とプレニルブロミド１．２１ｍｌ（１０．５ｍｍｏｌ）を続けて加えた。窒素雰囲気下、室温で１５時間撹拌した後、反応液を０．６％クエン酸水２３０ｍｌの中へ注ぎ、これを酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、５％クエン酸、５％炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン－酢酸エチルから再結晶し、化合物（Ｉ－３）４．０１ｇ（収率９０％）を無色結晶として得た。

（第５工程）化合物（Ｉ－１）の合成

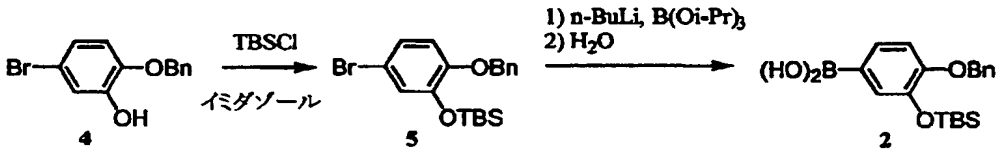
化合物（Ｉ－３）３．８０ｇ（５．７９ｍｍｏｌ）のジメチルスルホキシド溶液３８ｍｌに、４N水酸化ナトリウム１５ｍｌ（６０．０ｍｍｏｌ）を加え、反応

混合物を６０℃で４時間加温した。冷却後、１N塩酸１００ｍｌを加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、５％炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をメタノールから再結晶し、化合物（Ｉ－１）１．７２ｇ（収率７０％）を無色結晶として得た。

【００７６】

参考例１　化合物２の合成

【化２６】



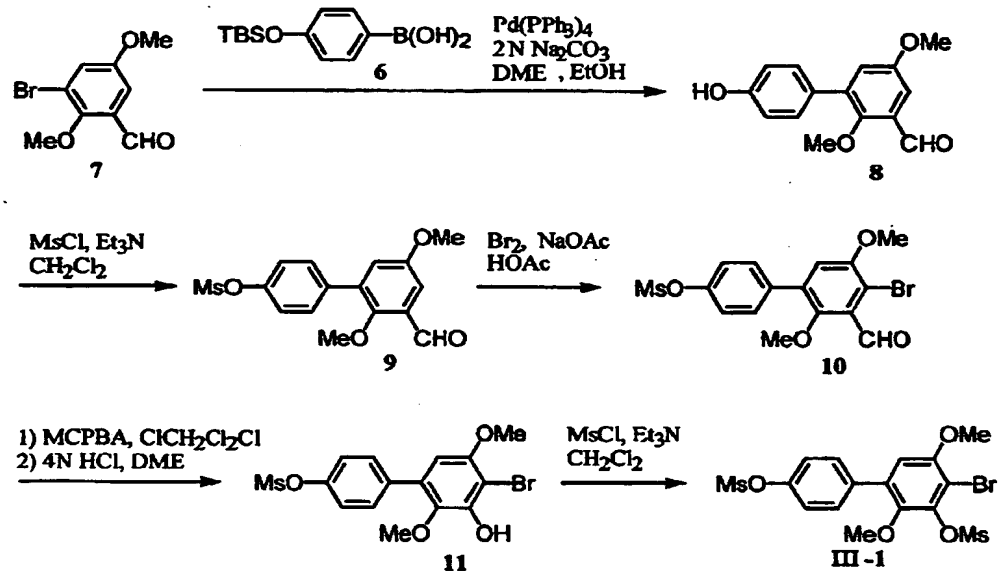

化合物４（８０．０ｇ；０．２８７ｍｏｌ）、t－ブチルジメチルシリルクロリド４５．８７ｇ（０．２９６ｍｏｌ）とイミダゾール２１．４６ｇ（０．３１５ｍｏｌ）のN，Ｎ－ジメチルホルムアミド溶液３３０ｍｌを室温で１９時間撹拌した。反応混合物を水１Ｌに注ぎ、エーテルで抽出した。抽出液を順次、水、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン－酢酸エチル５０：１）にて精製し、化合物５（９７．２０ｇ；収率８６％）を無色油状物として得た。

化合物５（９７．２０ｇ；０．２４７ｍｏｌ）の無水テトラヒドロフラン溶液８５０ｍｌに、窒素雰囲気下、－７０℃で１．６６Ｎ　ｎ－ブチルリチウム－ヘキサン溶液１５２ｍｌ（０．２５２ｍｏｌ）を加え、同温度で１．５時間撹拌した。そこへ、－７０℃でホウ酸トリイソプロピル１７１ｍｌ（０．７４１ｍｏｌ）を加え、ゆっくり室温に上げながら３時間撹拌した。氷冷下で水５００ｍｌ、５％クエン酸（３２０ｍｌ）を加え、同温度で３０分間撹拌した。反応液を酢酸エチルで抽出し、抽出液を順次、水、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン－酢酸エチル２：１）にて精製し、化合物２（５１．１０ｇ；収率５８％）を無色結晶として得た。

【００７７】

参考例２　化合物（III－１）の合成

【化２７】




【００７８】

（第１工程）化合物８の合成

化合物７（ジャーナル・オブ・ケミカル・ソサイエティー（Ｊｏｕｒｎａｌ　ｏｆ　Ｃｈｅｍｉｃａｌ　Ｓｏｃｉｅｔｙ）１９２５，１９９８記載）１５．３０ｇ（６２．４ｍｍｏｌ）の１，２－ジメトキシエタン３００ｍｌ溶液に、室温でテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（Ｏ）３．６０ｇ（３．１２ｍｍｏｌ）を加えた。そこへ、化合物６（イギリス特許公開公報第２２７６１６２号記載）１８．８９ｇ（７４．９ｍｍｏｌ）の９９％エタノール溶液８０ｍｌ、２M炭酸ナトリウム水溶液１２５ｍｌ（２５０ｍｍｏｌ）を加え、この反応懸濁液をアルゴン雰囲気下で、６時間加熱還流した。冷却後、反応混合物をろ過し、不溶物を除去した。ろ液を２N塩酸で酸性にした後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、５％炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン－酢酸エチル１：１）で精製後、ヘキサン－酢酸エチルより再結晶を行い、化合物８（１５．６８ｇ；収率９７％）を無色結晶として得た。

【００７９】

（第２工程）化合物９の合成

化合物8（15．34g；59．39mmol）の無水塩化メチレン240ml懸濁液に、氷冷下でトリエチルアミン16．6ml（118．8mmol）、続いてメタンスルホニルクロリド6．93ml（89．09mmol）を加え、同温度で2時間撹拌した。溶媒を留去した後、1N塩酸（100ml）で溶液を酸性にし、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、1N塩酸、5%炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン－酢酸エチルから再結晶し、化合物9（17．24g；収率86%）を無色結晶として得た。

【0080】

（第3工程）化合物10の合成

化合物9（17．03g；50．63mmol）の酢酸懸濁液210mlに、室温で酢酸ナトリウム6．23g（75．95mmol）と臭素3．91ml（75．95mmol）を加え、同温度で16時間撹拌した。この反応懸濁液に臭素3．91ml（75．95mmol）を加え、50℃で4時間撹拌した後、更に臭素3．91ml（75．95mmol）を加え、50℃で3時間撹拌した。反応混合物を1Mチオ硫酸ナトリウム水1Lへ注ぎ、30分間撹拌した。析出している結晶をろ取し、水洗後、結晶をクロロホルム800mlに溶解し、順次、5%炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮した。残渣をヘキサン－酢酸エチルから再結晶し、化合物10（18．12g；収率86%）を無色結晶として得た。

【0081】

（第4工程）化合物11の合成

化合物10（15．80g；38．05mmol）の1，2－ジクロロエタン懸濁液400mlに、室温で80%m－クロロ過安息香酸12．30g（57．05mmol）を加え、同温度で17時間撹拌した。反応混合物を0．2Mチオ硫酸ナトリウム水360mlへ注ぎ、クロロホルムで抽出した。抽出液を順次、0．2Mチオ硫酸ナトリウム300ml、5%炭酸水素ナトリウム水溶液200ml×2で洗浄し、乾燥、濃縮した。こうして得られた残渣15．80gを1，2－ジメトキシエタン330mlに溶解し、これに4N塩酸30ml（120m

ｍｏｌ）を加えた。反応混合物を５０℃で１２時間撹拌して冷却した後、溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、５％炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し、乾燥、濃縮して、化合物１１（１４．３５ｇ；収率９７％）を淡褐色結晶として得た。

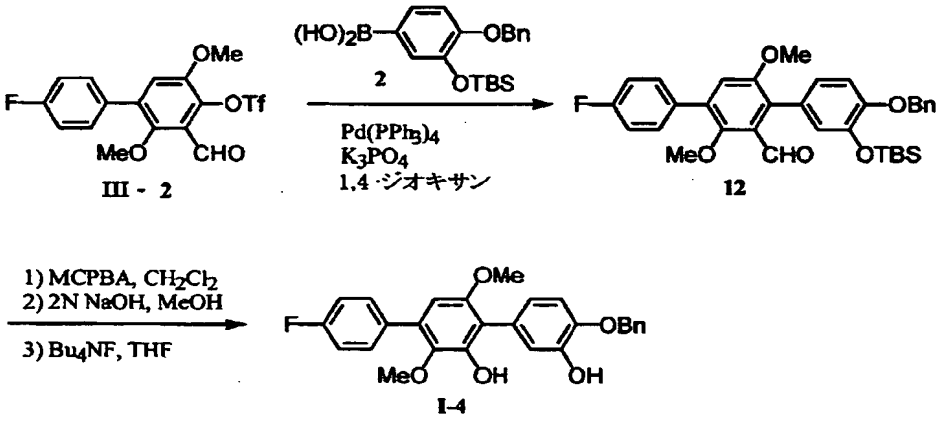
（第５工程）化合物（III－１）の合成

化合物（Ｉ－４）と同様にして、化合物１１（１２．０ｇ；２９．７６ｍｍｏｌ）から化合物（III－１）１２．６３ｇ（収率８８％）を無色結晶として得た。

【００８２】

実施例２　化合物（Ｉ－４）の合成

【化２８】




【００８３】

（第１工程）化合物１２の合成

化合物（III－２）８１６㎎（２ｍｍｏｌ）の１，４－ジオキサン４０ｍｌの溶液に、室温でテトラキス（トリフェニルホスフィン）パラジウム（０）１１４㎎（０．１ｍｍｏｌ）、化合物２７４８㎎（２．０９ｍｍｏｌ）、粉末無水リン酸カリウム５８９㎎（２．７７ｍｍｏｌ）を加え窒素雰囲気下で２３時間８５℃で加熱した。反応液を冷却後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次２Ｎ塩酸、５％炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン－酢酸エチル４：１）で精製し、ペンタンで結晶化することにより化合物１２（７４５㎎；収率６７％）を淡黄色結晶

として得た。

【００８４】

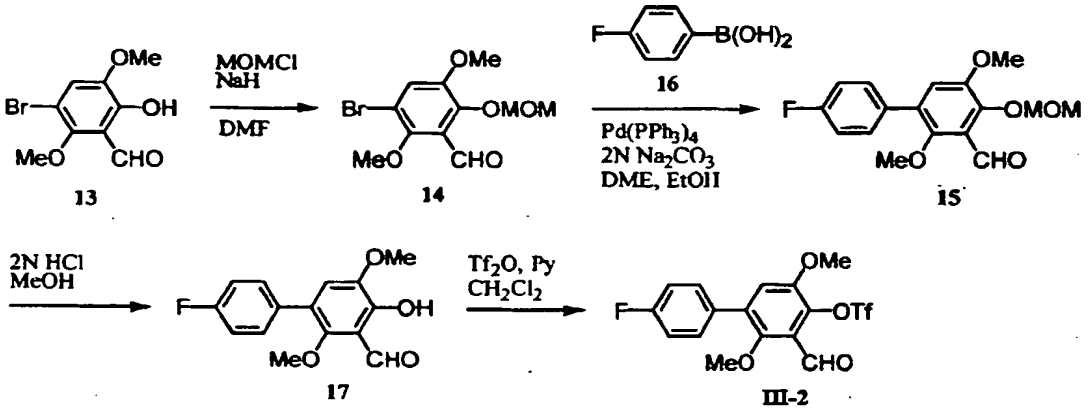
（第２工程）化合物（Ｉ－４）の合成

化合物１２（５５７ｍｇ；１ｍｍｏｌ）の塩化メチレン１０ｍｌの溶液に室温で８０％ｍ－クロロ過安息香酸２５９ｍｇ（１．２ｍｍｏｌ）を加え１５時間撹拌した。反応液を０．１Ｍチオ硫酸ナトリウム水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次０．１Ｍチオ硫酸ナトリウム水、５％炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。得られた残渣６５０ｍｇのメタノール５ｍｌの溶液に氷冷下で１Ｍナトリウムメチラートのメタノール溶液２ｍｌを加え３０分間撹拌した。反応液を２Ｎ塩酸で酸性とし、酢酸エチルで抽出し、その抽出液を飽和食塩水で洗浄、乾燥した後濃縮した。得られた残渣６４７ｍｇのテトラヒドロフラン１０ｍｌの溶液に氷冷下で１Ｍテトラブチルアンモニウムフルオライドのテトラヒドロフラン溶液２ｍｌを加え３０分間撹拌した。反応液を氷冷下で２Ｎ塩酸水に注ぎ酸性とし酢酸エチルで抽出した。酢酸エチル層を順次、水、５％炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン－酢酸エチル２：１）で精製することにより化合物（Ｉ－４）２７５ｍｇ（収率６２％）を粉末として得た。

【００８５】

参考例３　化合物（III－２）の合成

【化２９】



【００８６】

（第１工程）化合物１４の合成

化合物１３（ジャーナル・オブ・オーガニック・ケミストリー（Ｊｏｕｒｎａｌ　ｏｆ　Ｏｒｇａｎｉｃ　Ｃｈｅｍｉｓｔｒｙ）１９８７，５２，４４８５）２．６１ｇ（１０ｍｍｏｌ）のジメチルホルムアミド溶液２６ｍｌに氷冷下６０％油性水素化ナトリウム４００ｍｇ（１０ｍｍｏｌ）とクロロメチルメチルエーテル８３６ｍｇ（１１ｍｍｏｌ）を加え３０分間撹拌した。反応温度を室温にした後、更に１時間撹拌した。反応液は減圧下濃縮後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、５％炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。残渣を酢酸エチルーヘキサンーペンタンより再結晶を行い化合物１４（２．８ｇ；９２％）を得た。

【００８７】

（第２工程）化合物１５の合成

化合物８と同様にして、化合物１４と化合物１６（東京化成製）を用いて化合物１５を淡黄色油状物質として得た（収率９６％）。

【００８８】

（第３工程）化合物１７の合成

化合物１５　１．３８ｇ（４．３ｍｍｏｌ）のメチルアルコールの懸濁液１６ｍｌに２Ｎ塩酸水４ｍｌを加え６０℃に加温下、１時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮した後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次、５％炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥，濃縮することにより化合物１７（１．１２ｇ；収率９４％）を黄色結晶性残渣として得た。

【００８９】

（第４工程）化合物（III－２）の合成

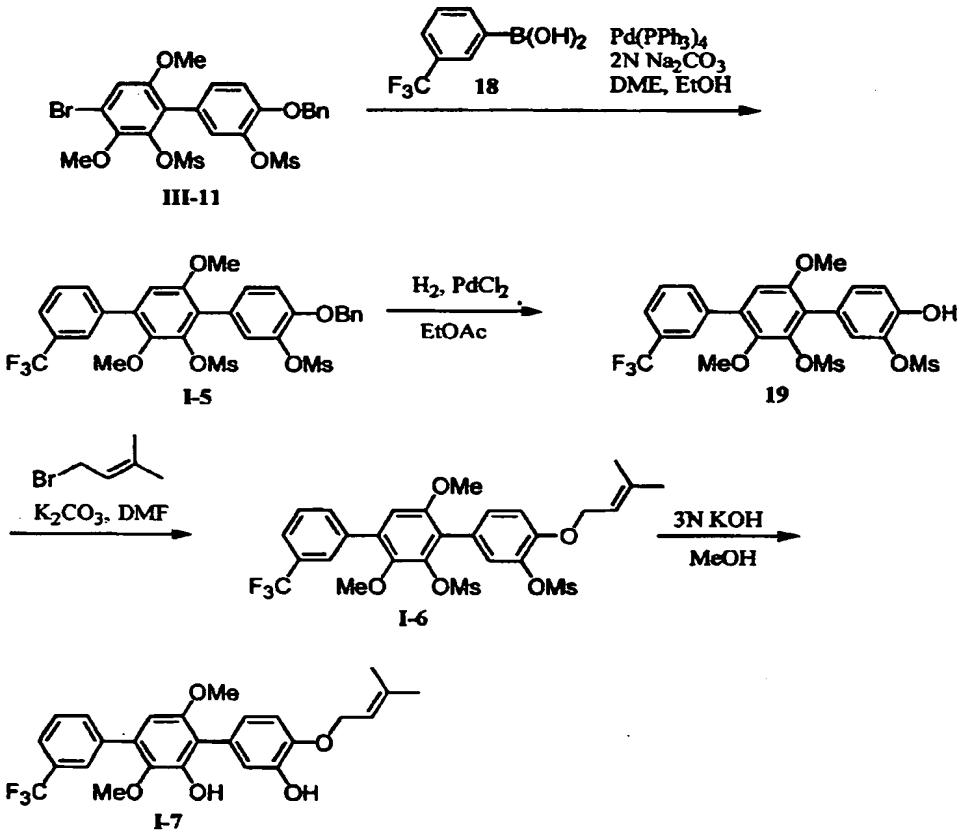
化合物１７（１．１２ｇ；４．０５ｍｍｏｌ）の無水塩化メチレン溶液１２ｍｌに氷冷下で無水トリフルオロタンスルホン酸１．０２ｍｌ（６．０８ｍｍｏｌ）続いてピリジン９８０ｍｌ（１２．２ｍｍｏｌ）を加え３０分間撹拌した。反応温度を室温に上げ、更に２時間撹拌した後、溶媒を留去した。残渣を酢酸エチルで抽出し順次、５％炭酸水素ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した

。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン－酢酸エチル９：１）で精製することにより化合物（III－２）１．２３ｇ（収率７４％）を白色結晶性残渣として得た。

【００９０】

実施例３　化合物（Ｉ－５）、（Ｉ－６）、（Ｉ－７）の合成

【化３０】




【００９１】

（第１工程）化合物（Ｉ－５）の合成

実施例１記載の化合物１と同様にして化合物（III－１１）８８１ｍｇ（１．５０ｍｍｏｌ）、３－トリフルオロメチルホウ酸３７０ｍｇ（１．９５ｍｍｏｌ）より化合物（Ｉ－５）６３４ｍｇ（０．９７２ｍｍｏｌ）を合成した。収率６５％。

（第２工程）化合物１９の合成

実施例１の化合物３と同様にして化合物（Ｉ－５）４３３ｍｇ（０．６６４ｍ

ｍｏｌ）より化合物１９（３６０ｍｇ；０．６４０ｍｍｏｌ）を合成した。収率９６％。

【００９２】

（第３工程）化合物（Ｉ－６）の合成

実施例１の化合物（Ｉ－３）と同様にして化合物１９（１７０ｍｇ；０．３０２ｍｍｏｌ）より化合物（Ｉ－６）１８５ｍｇ（０．２９３ｍｍｏｌ）を合成した。収率９７％。

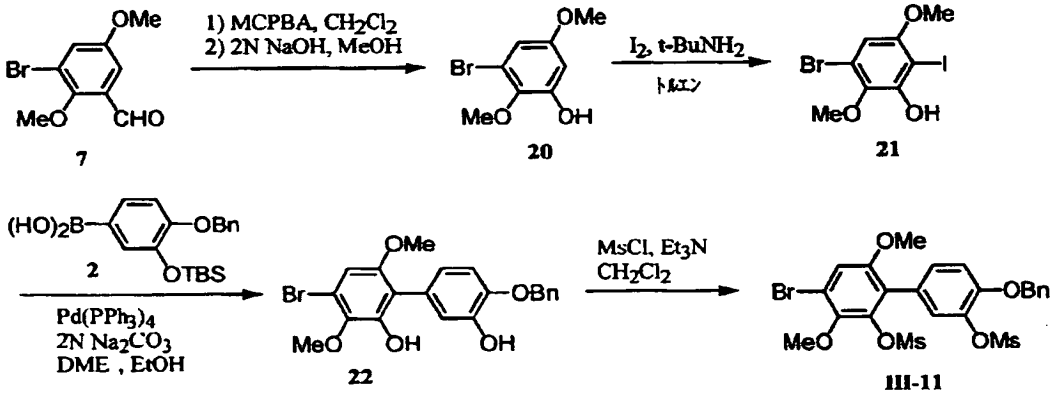
（第４工程）化合物（Ｉ－７）の合成

実施例１の化合物（Ｉ－１）と同様にして化合物（Ｉ－６）１５０ｍｇ（０．２３８ｍｍｏｌ）より化合物（Ｉ－７）８５ｍｇ（０．１７９ｍｍｏｌ）を合成した。収率７５％。

【００９３】

参考例４　化合物（III－１１）の合成

【化３１】




【００９４】

（第１工程）化合物２０の合成

参考例２の化合物１１と同様にして化合物７（４０．０３ｇ；１６３ｍｍｏｌ）より化合物２０（２４．０４ｇ；１０３ｍｍｏｌ）を合成した。収率６３％。

（第２工程）化合物２１の合成

窒素気流下、トルエン１０ｍｌにｔｅｒｔ－ブチルアミン（５．０ｍｌ，４７．８ｍｍｏｌ）を加え、室温で５０分間撹拌した。この溶液に氷冷下、化合物２

0（5．46g；23．43mmol）を加え室温に昇温し、6日間撹拌した。反応液を1Mチオ硫酸ナトリウム水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。抽出液を順次1Mチオ硫酸ナトリウム水、飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮し、化合物21（8．30g；23．16mmol）を合成した。収率99%。

【0095】

（第3工程）化合物22の合成

実施例1の化合物1と同様にして化合物21（8．70g；24．20mmol）より化合物22（2．10g；4．87mmol）を合成した。収率20%。

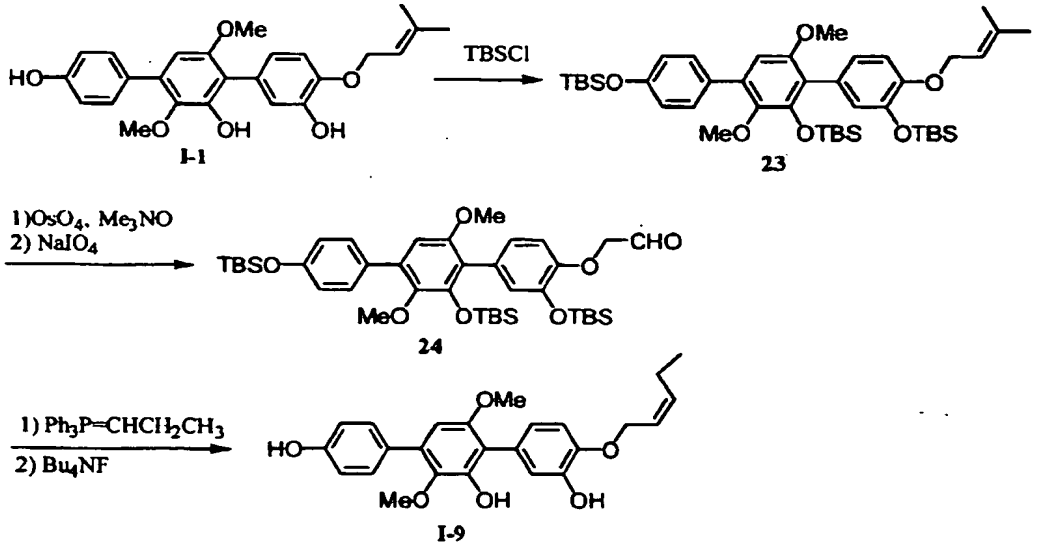
（第4工程）化合物（III－11）の合成

実施例1の化合物（I－2）と同様にして化合物22（3．20g；7．42mmol）より化合物（III－11）2．61g（4．44mmol）を合成した。収率60%。

【0096】

実施例4　化合物（I－9）の合成

【化32】




【0097】

（第1工程）化合物23の合成

化合物（I－1）1．53g（3．63mmol）を参考例1と同様にシリル

化を行い、粗生成物をメタノールより結晶化することにより化合物２３（２．６２ｇ；収率９５％）を無色の結晶として得た。

【００９８】

（第２工程）化合物２４の合成

化合物２３（２．３８ｇ；３．１ｍｍｏｌ）のアセトン９０ｍｌの溶液に、トリメチルアミン－Ｎ－オキシド二水和物４１５ｍｇ（３．７４ｍｍｏｌ）、５％四酸化オスミウム水溶液１．６０ｍｌ（０．３ｍｍｏｌ）を加え室温にて１時間撹拌した。反応液に水２０ｍｌを加え、次いで炭酸水素ナトリウム４．０ｇ、亜硫酸水素ナトリウム４．０ｇを加え３０分間撹拌した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。

上記のようにして得られた残渣２．４６ｇのエタノール９０ｍｌの溶液に、室温撹拌下、過ヨウ素酸ナトリウム１．９６ｇ（９．１６ｍｍｏｌ）の水３３ｍｌの溶液を４０分間にて滴加した。２時間撹拌した後、反応液に水１００ｍｌを少量ずつ加え、析出した沈殿物を炉取し、乾燥することにより化合物２４（１．９８ｇ；収率８７％）を粉末として得た。

【００９９】

（第３工程）化合物（Ｉ－９）の合成

臭化ｎ－プロピルトリフェニルホスホニウム１４６ｍｇ（０．３８ｍｍｏｌ）の乾燥テトラヒドロフラン２．５ｍｌの懸濁液に、窒素雰囲気下、０℃にてカリウム－ｔ－ブトキシド３２ｍｇ（０．２９ｍｍｏｌ）を加え、同温度にて１時間撹拌した。反応液を－７８℃に冷却し、化合物２４（７０ｍｇ；０．０９５ｍｍｏｌ）の乾燥テトラヒドロフラン１．５ｍｌ溶液を加え、同温度にて３０分間、次いで室温にて１時間撹拌した。反応液を氷冷した飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し乾燥、濃縮した。

上記のようにして得られた残渣７０ｍｇを実施例２の第２工程と同様に脱シリル化を行い、粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー（トルエン－酢酸エチル４：１）で精製し、化合物（Ｉ－９）３７ｍｇ（収率９３％）を淡黄色結晶として得た。

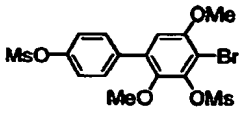
【0100】

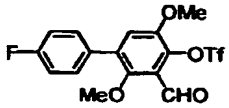
実施例5　その他の化合物（I）の合成

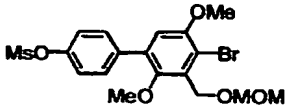
以下、同様にして以下の化合物（I）を合成した。以下に化合物（III）および化合物（I）の構造および物理恒数を示す。

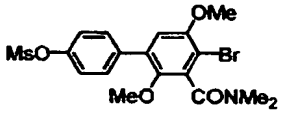
【0101】

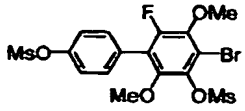
【化33】

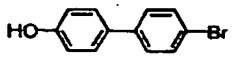
III-1 

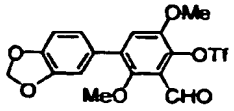
III-2 

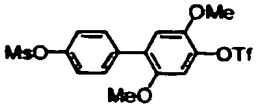
III-3 

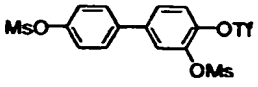
III-4 

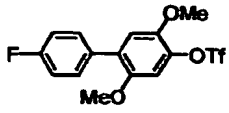
III-5 

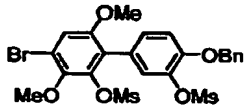
III-6 

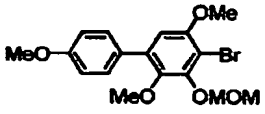
III-7 

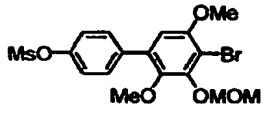
III-8 

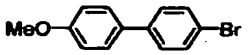
III-9 

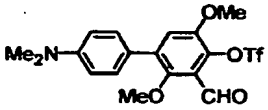
III-10 

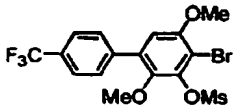
III-11 

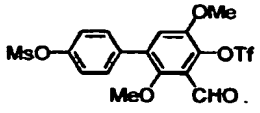
III-12 

III-13 

III-14 

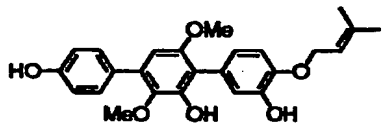
III-15 

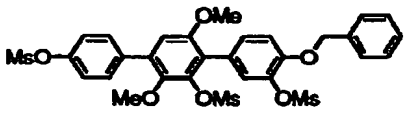
III-16 

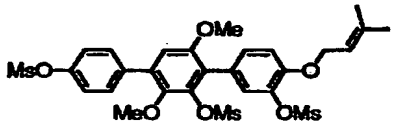
III-17 

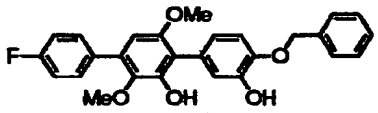
【0102】

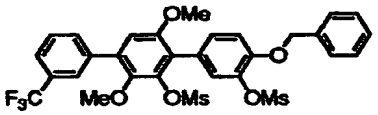
【化34】

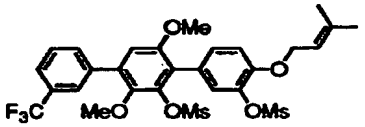
I-1 

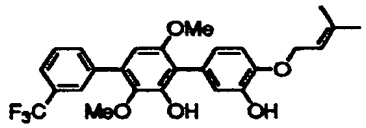
I-2 

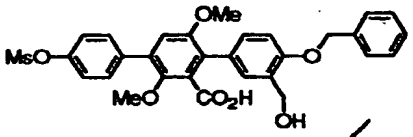
I-3 

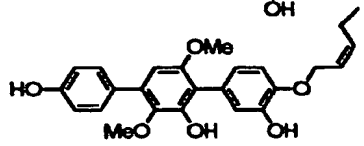
I-4 

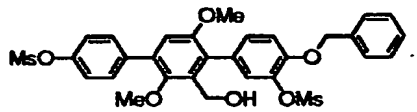
I-5 

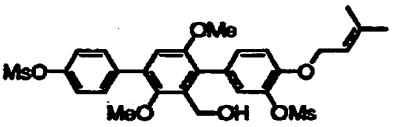
I-6 

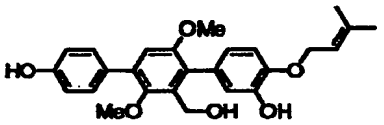
I-7 

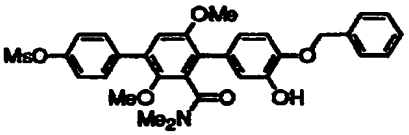
I-8 

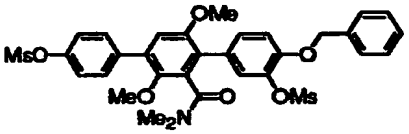
I-9 

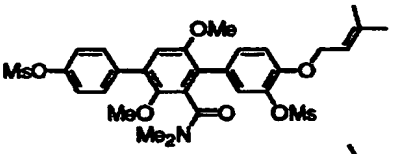
I-10 

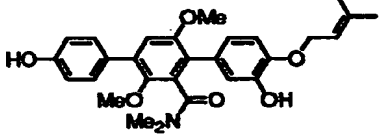
I-11 

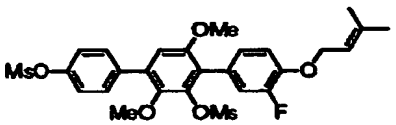
I-12 

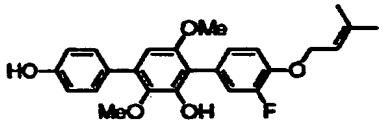
I-13 

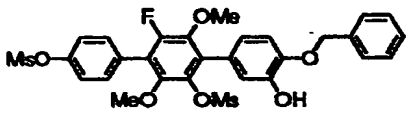
I-14 

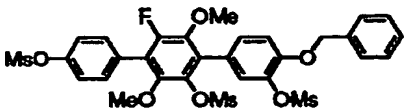
I-15 

I-16 

I-17 

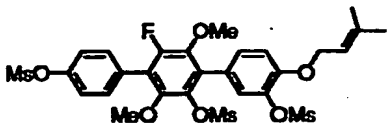
I-18 

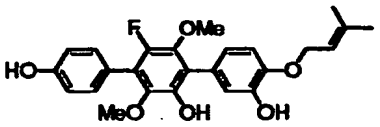
I-19 

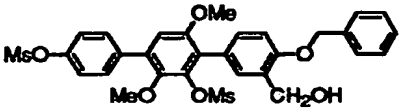
I-20 

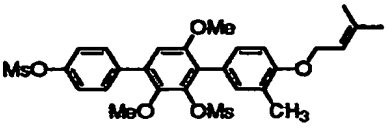
【0103】

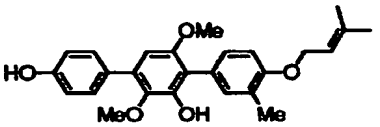
【化35】

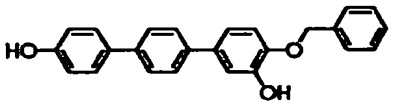
I-21 

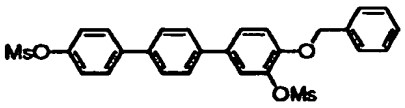
I-22 

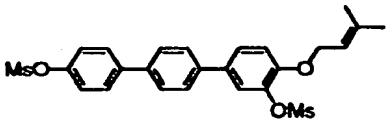
I-23 

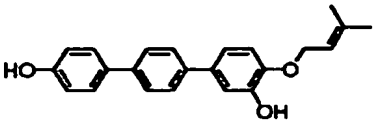
I-24 

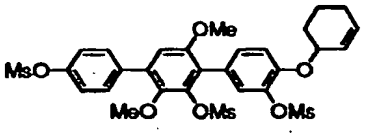
I-25 

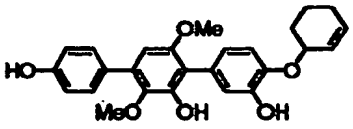
I-26 

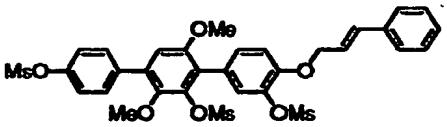
I-27 

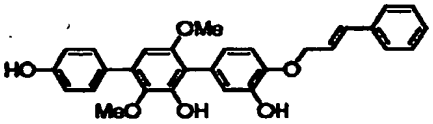
I-28 

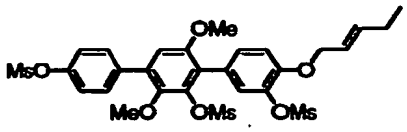
I-29 

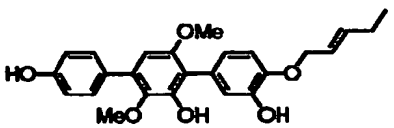
I-30 

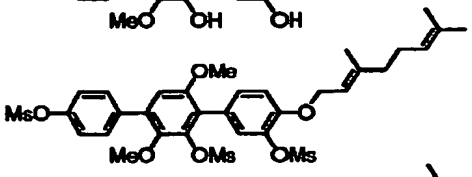
I-31 

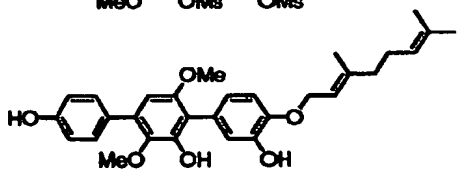
I-32 

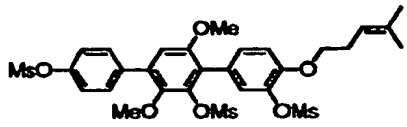
I-33 

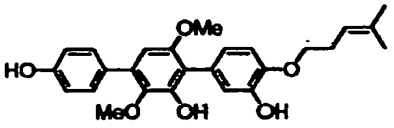
I-34 

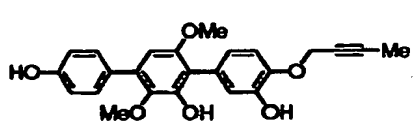
I-35 

I-36 

I-37 

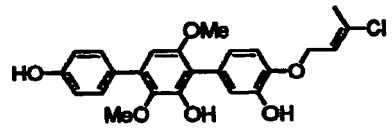
I-38 

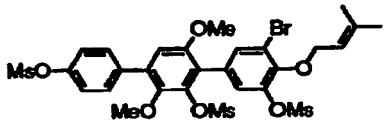
I-39 

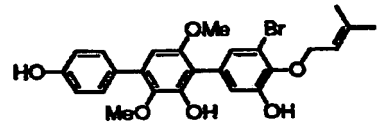
I-40 

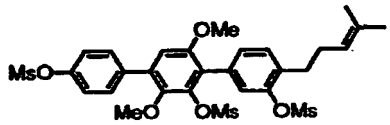
【0104】

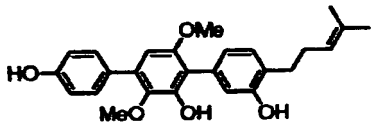
【化36】

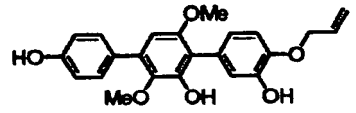
I-41 

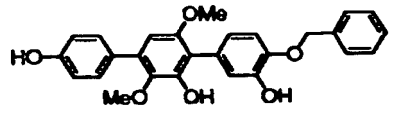
I-42 

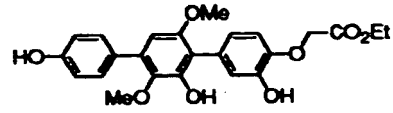
I-43 

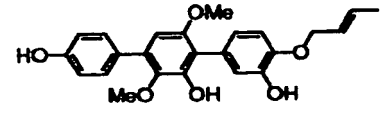
I-44 

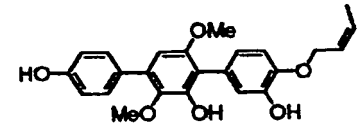
I-45 

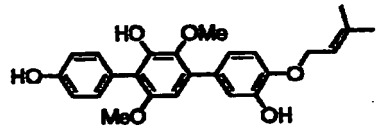
I-46 

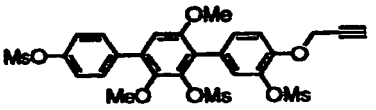
I-47 

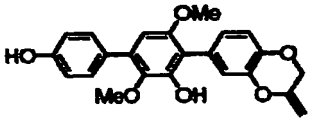
I-48 

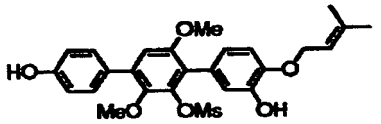
I-49 

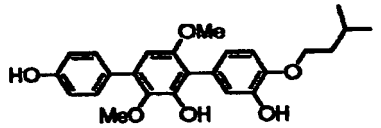
I-50 

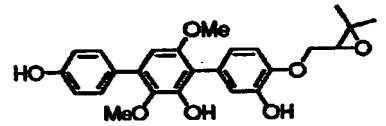
I-51 

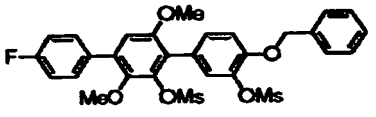
I-52 

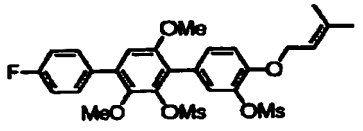
I-53 

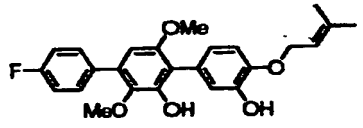
I-54 

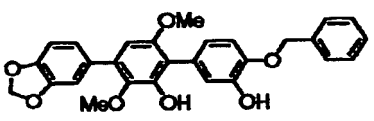
I-55 

I-56 

I-57 

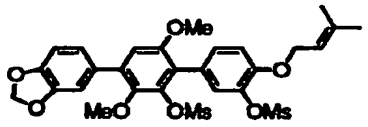
I-58 

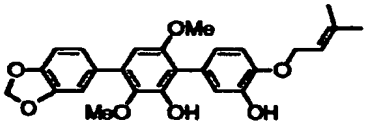
I-59 

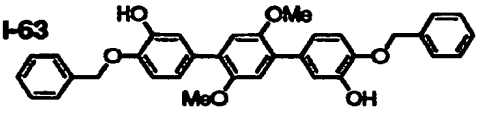
I-60 

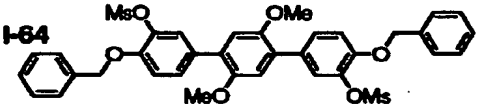
【0105】

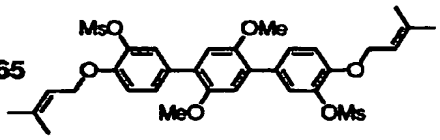
【化37】

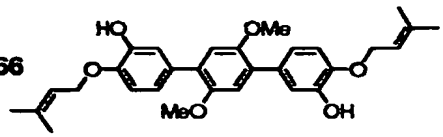
I-61 

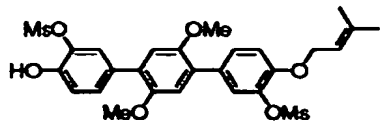
I-62 

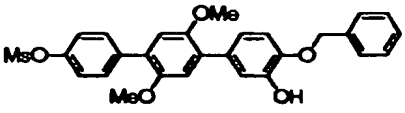
I-63 

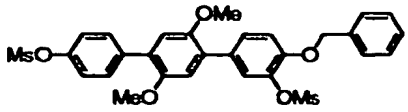
I-64 

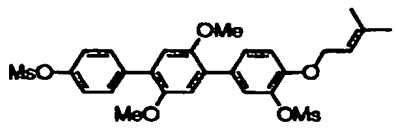
I-65 

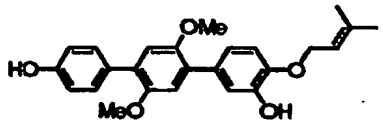
I-66 

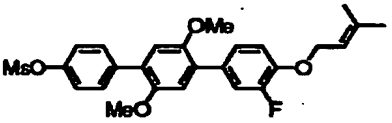
I-67 

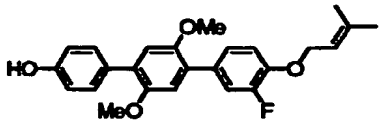
I-68 

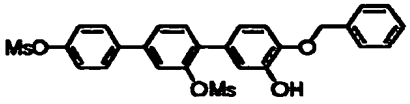
I-69 

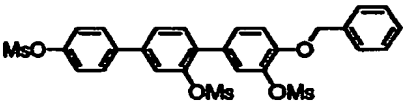
I-70 

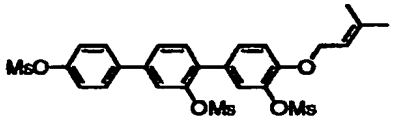
I-71 

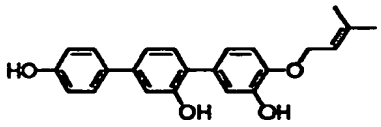
I-72 

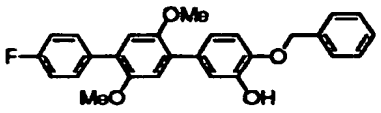
I-73 

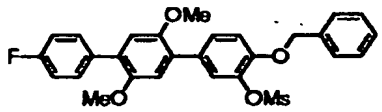
I-74 

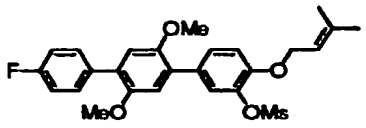
I-75 

I-76 

I-77 

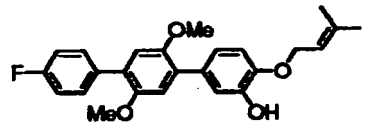
I-78 

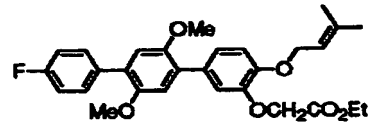
I-79 

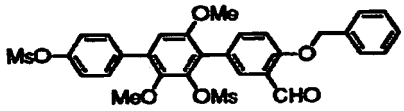
I-80 

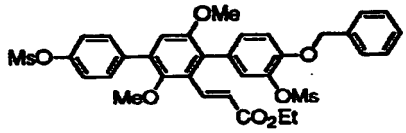
【0106】

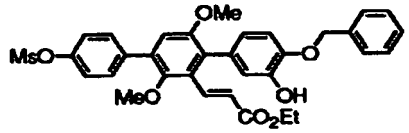
【化38】

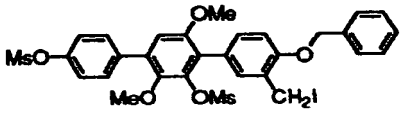
I-81 

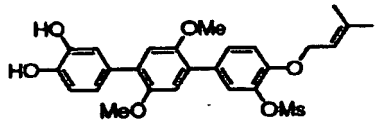
I-82 

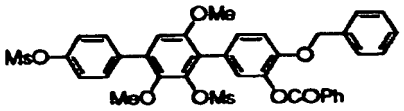
I-83 

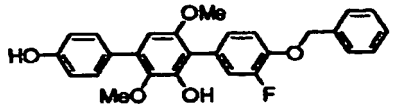
I-84 

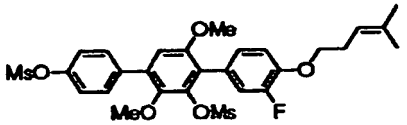
I-85 

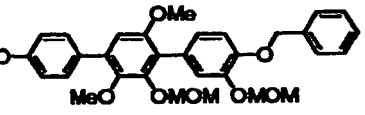
I-86 

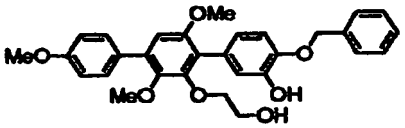
I-87 

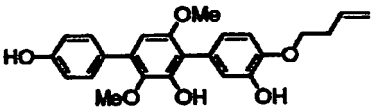
I-88 

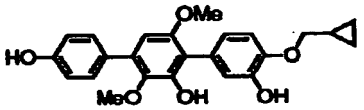
I-89 

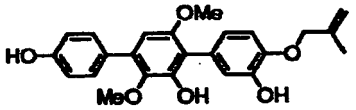
I-90 

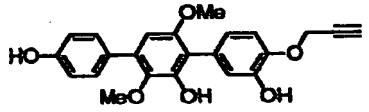
I-91 

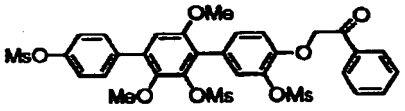
I-92 

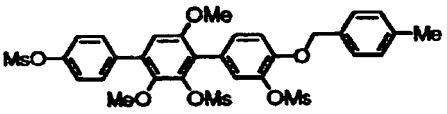
I-93 

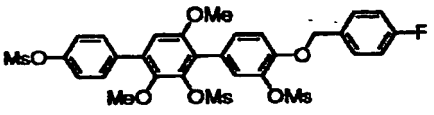
I-94 

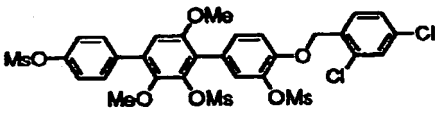
I-95 

I-96 

I-97 

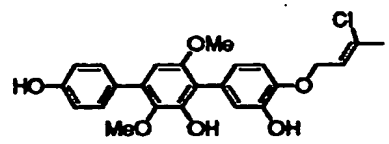
I-98 

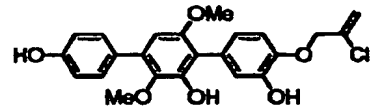
I-99 

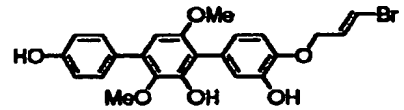
I-100 

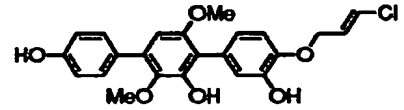
【0107】

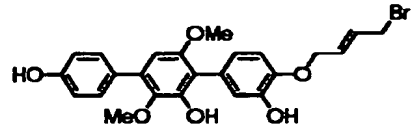
【化39】

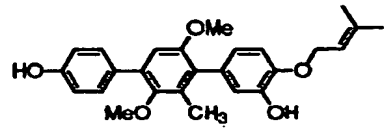
I-101 

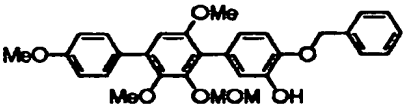
I-102 

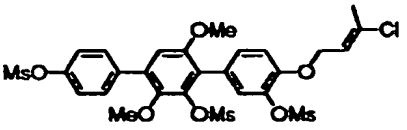
I-103 

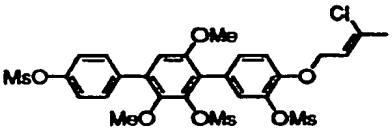
I-104 

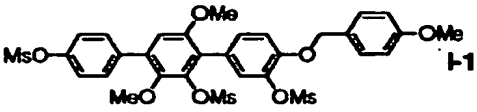
I-105 

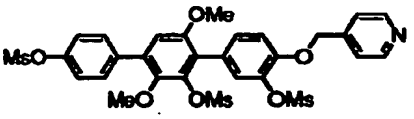
I-106 

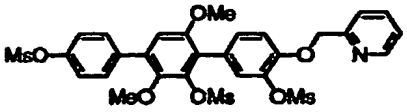
I-107 

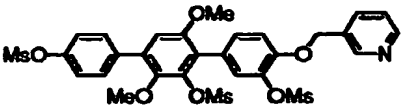
I-108 

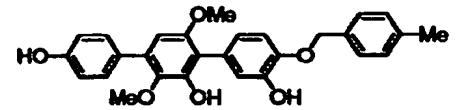
I-109 

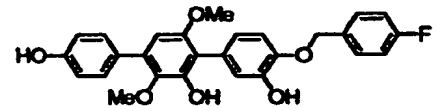
I-110 

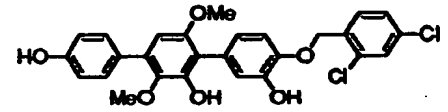
I-111 

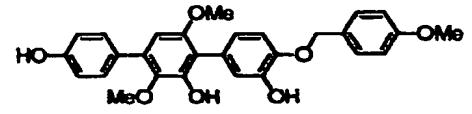
I-112 

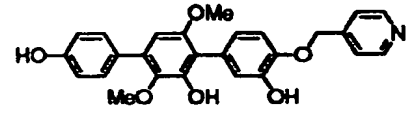
I-113 

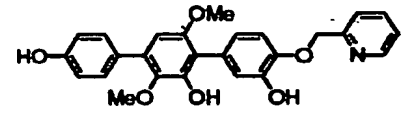
I-114 

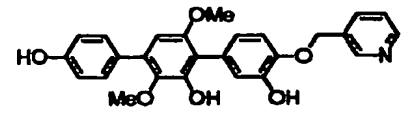
I-115 

I-116 

I-117 

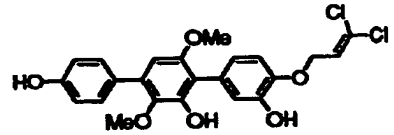
I-118 

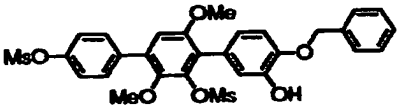
I-119 

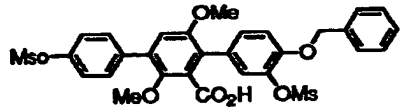
I-120 

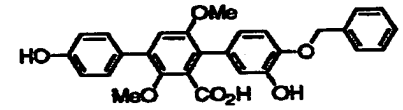
【0108】

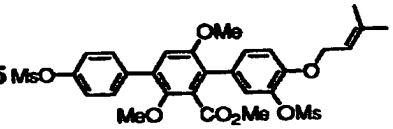
【化40】

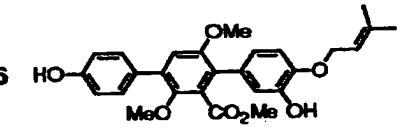
I-121 

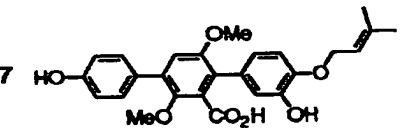
I-122 

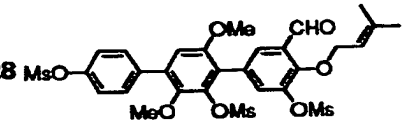
I-123 

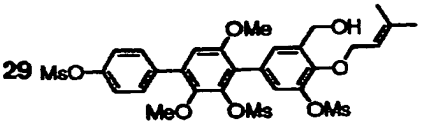
I-124 

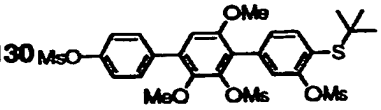
I-125 

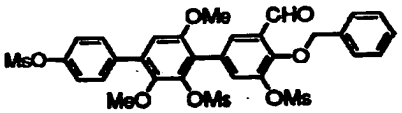
I-126 

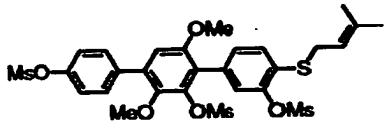
I-127 

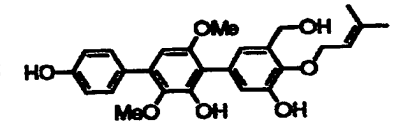
I-128 

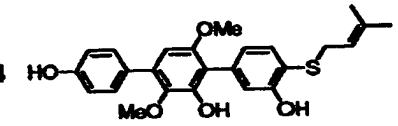
I-129 

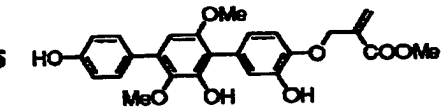
I-130 

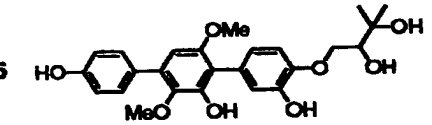
I-131 

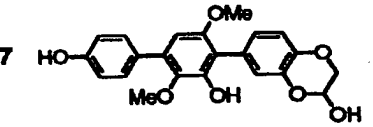
I-132 

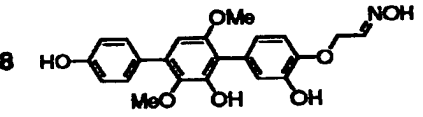
I-133 

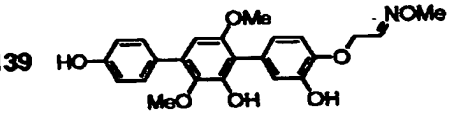
I-134 

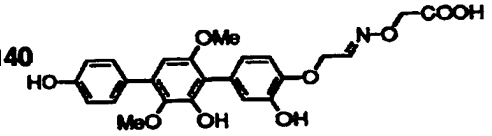
I-135 

I-136 

I-137 

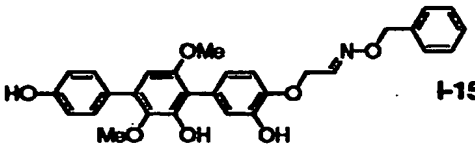
I-138 

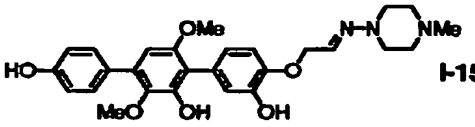
I-139 

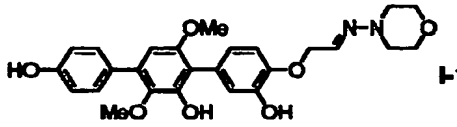
I-140 

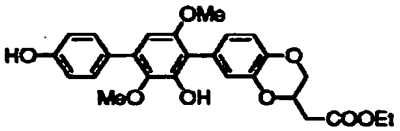
【0109】

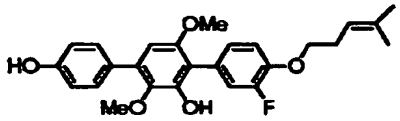
【化41】

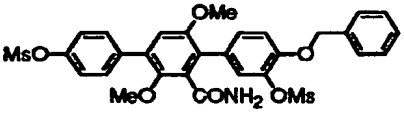
I-141 

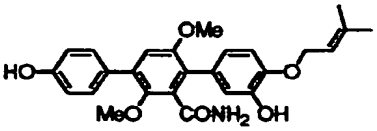
I-142 

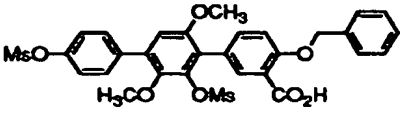
I-143 

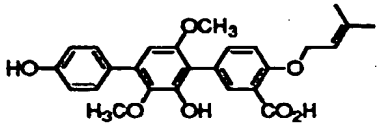
I-144 

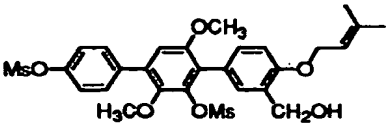
I-145 

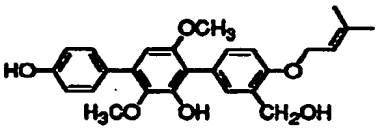
I-146 

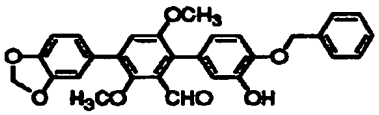
I-147 

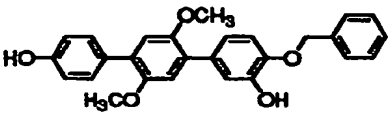
I-148 

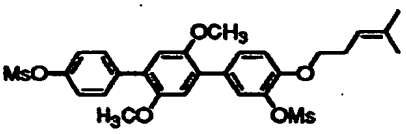
I-149 

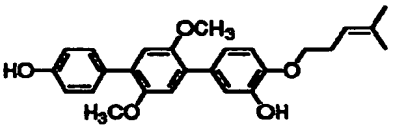
I-150 

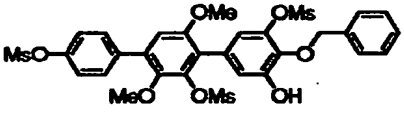
I-151 

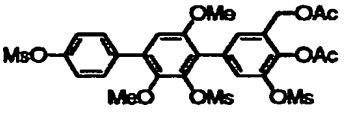
I-152 

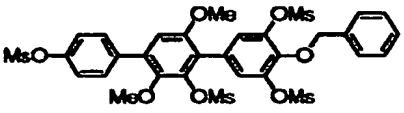
I-153 

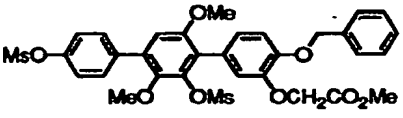
I-154 

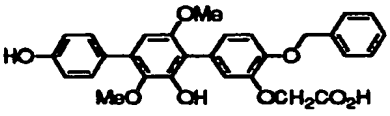
I-155 

I-156 

I-157 

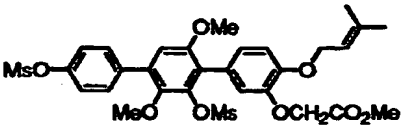
I-158 

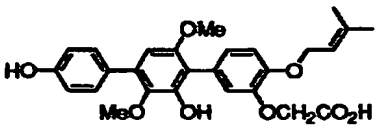
I-159 

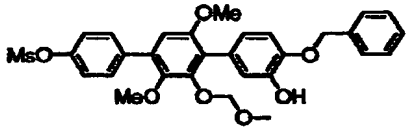
I-160 

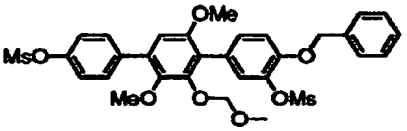
【0110】

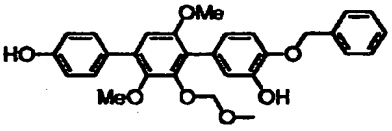
【化42】

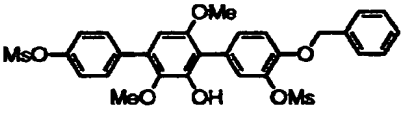
I-161 

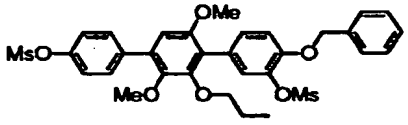
I-162 

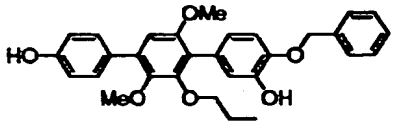
I-163 

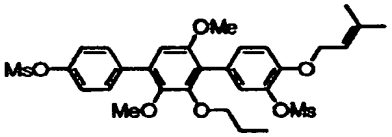
I-164 

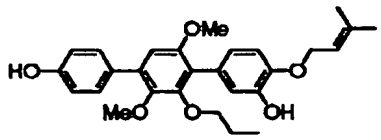
I-165 

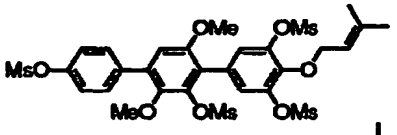
I-166 

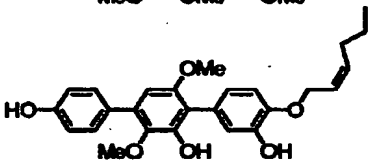
I-167 

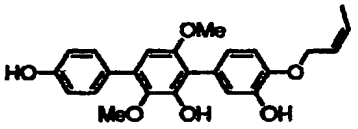
I-168 

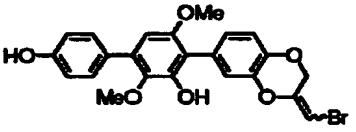
I-169 

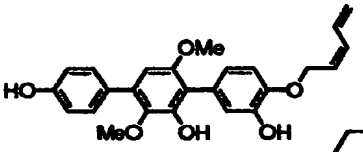
I-170 

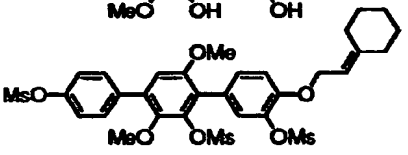
I-171 

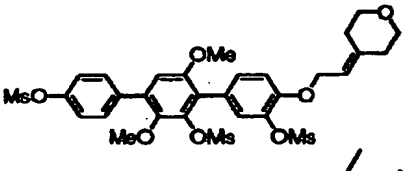
I-172 

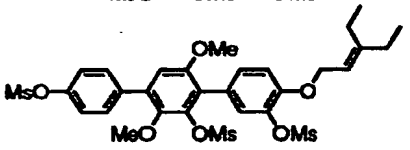
I-173 

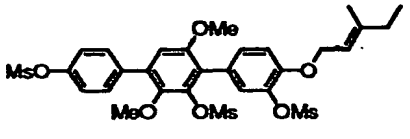
I-174 

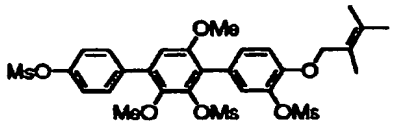
I-175 

I-176 

I-177 

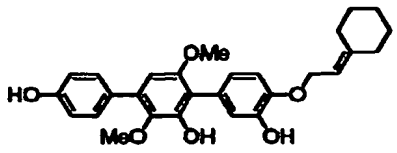
I-178 

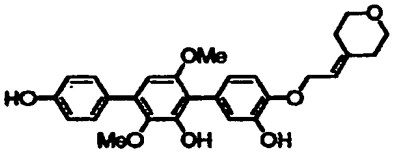
I-179 

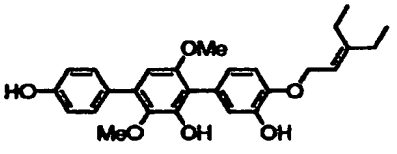
I-180 

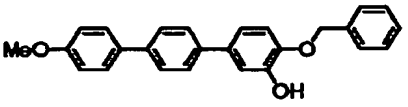
【0111】

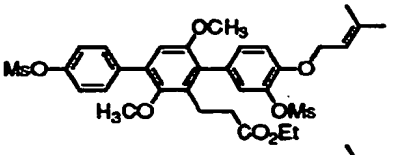
【化43】

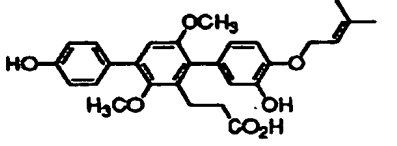
I-181 

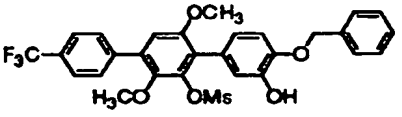
I-182 

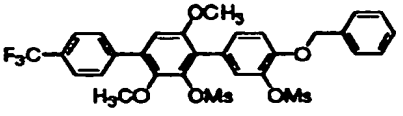
I-183 

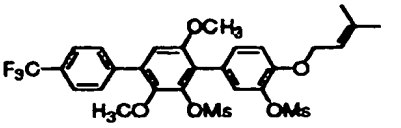
I-184 

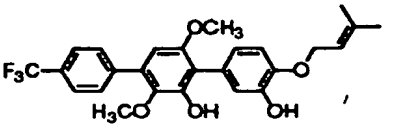
I-185 

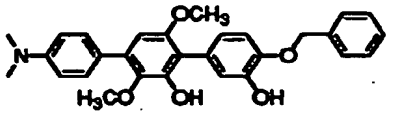
I-186 

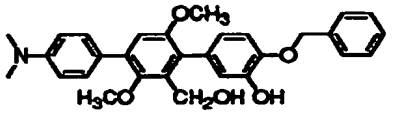
I-187 

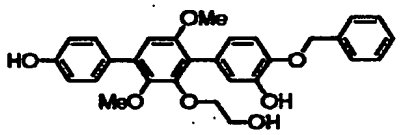
I-188 

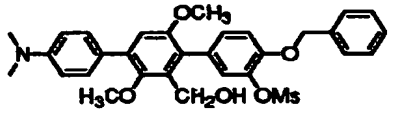
I-189 

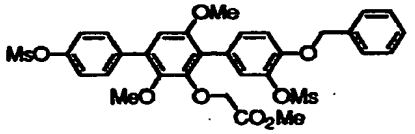
I-190 

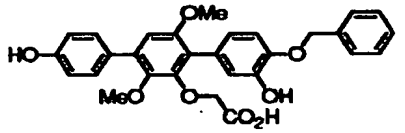
I-191 

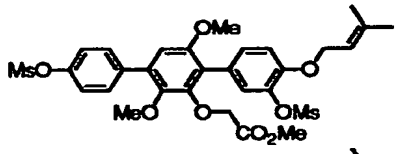
I-192 

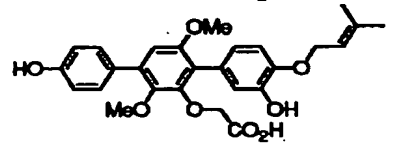
I-193 

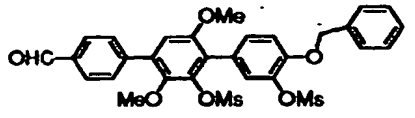
I-194 

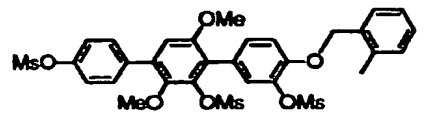
I-195 

I-196 

I-197 

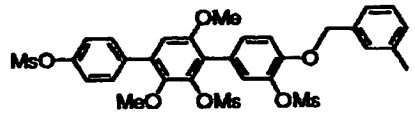
I-198 

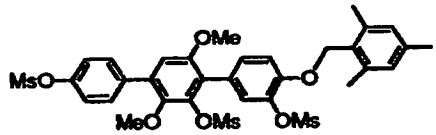
I-199 

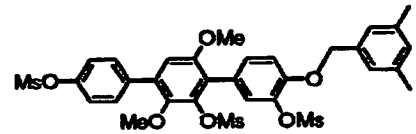
I-200 

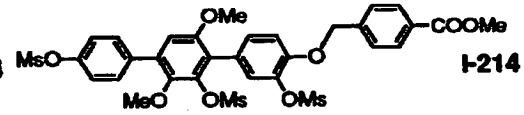
【0112】

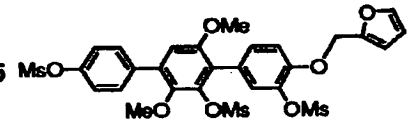
【化44】

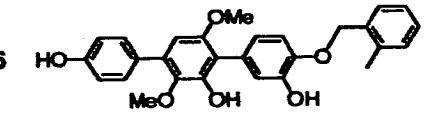
I-201 

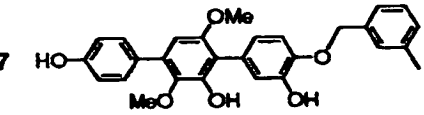
I-202 

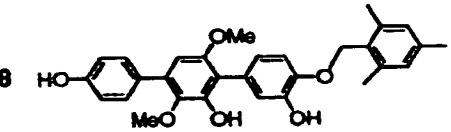
I-203 

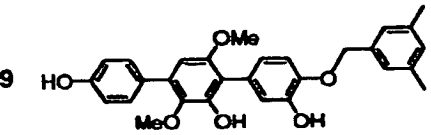
I-204 

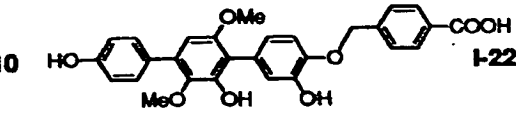
I-205 

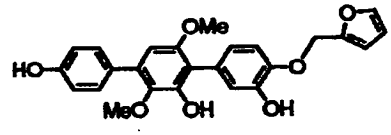
I-206 

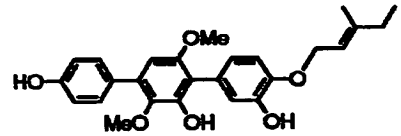
I-207 

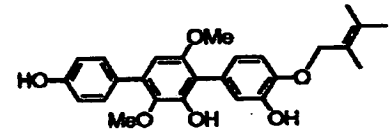
I-208 

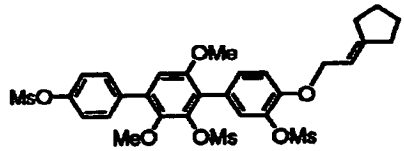
I-209 

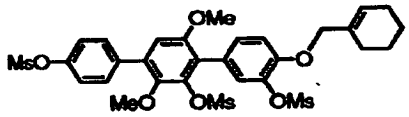
I-210 

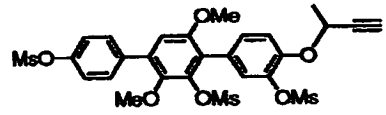
I-211 

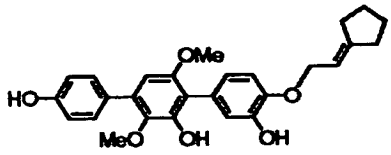
I-212 

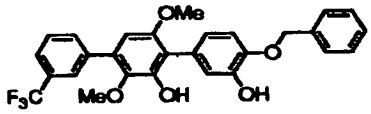
I-213 

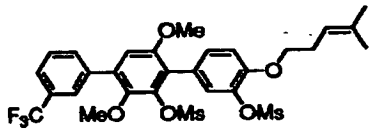
I-214 

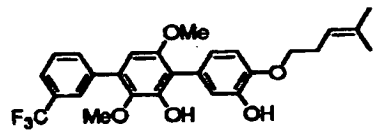
I-215 

I-216 

I-217 

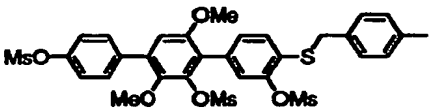
I-218 

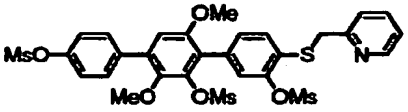
I-219 

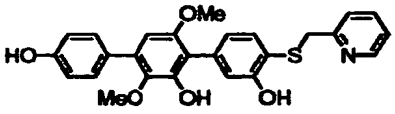
I-220 

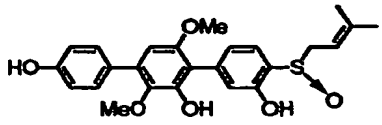
【0113】

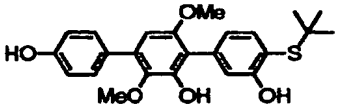
【化45】

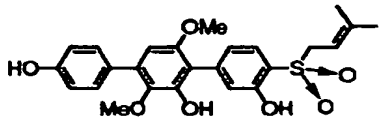
I-221 

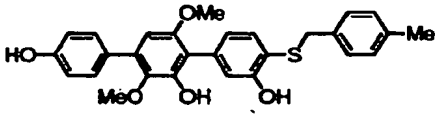
I-222 

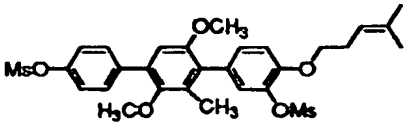
I-223 

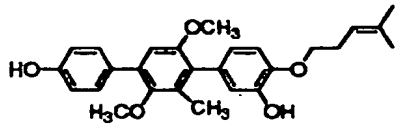
I-224 

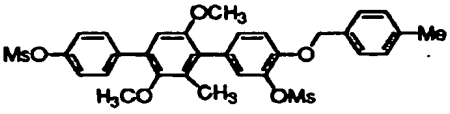
I-225 

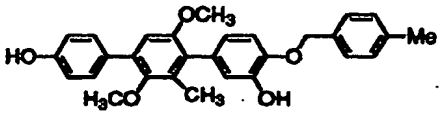
I-226 

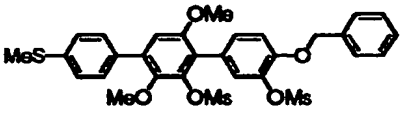
I-227 

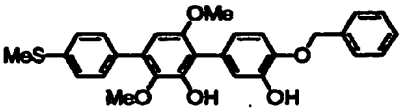
I-228 

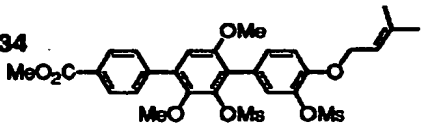
I-229 

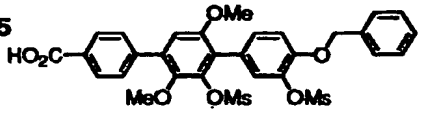
I-230 

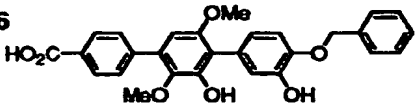
I-231 

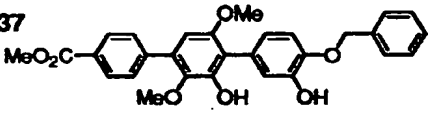
I-232 

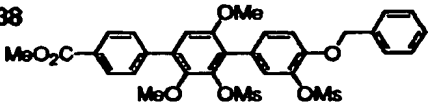
I-233 

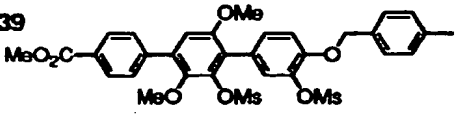
I-234 

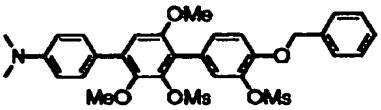
I-235 

I-236 

I-237 

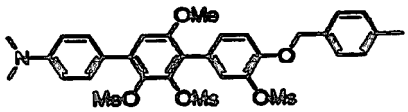
I-238 

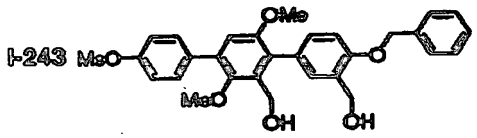
I-239 

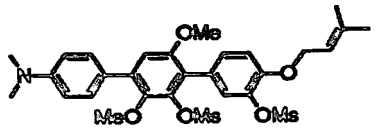
I-240 

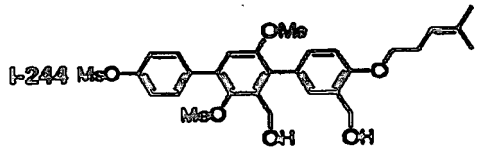
【0114】

【化46】

I-241 

I-243 

I-242 

I-244 

【0115】

III-1

mp 201-203 ℃

$^1$HNMR (DMSO-$d_6$) δ 3.44 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.62 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 7.09 (s, 1H), 7.40-7.53 (m, 2H), 7.65-7.78 (m, 2H)

IR (KBr) 1476, 1372, 1359, 1180, 1150, 1088 $cm^{-1}$

III-2

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.47 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 7.13-7.24 (m, 3H), 7.50-7.59 (m, 2H), 10.41 (s, 1H)

IR (KBr) 1700, 1562, 1479, 1438, 1393, 1226, 1199, 1180, 1161, 1076, 1047 $cm^{-1}$

【0116】

III-3

mp 181-182 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.21 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 4.81 (s, 2H), 4.85 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.32-7.40 (m, 2H), 7.60-7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1504, 1467, 1370, 1235, 1152, 1038, 1010, 870, 846, 785 $cm^{-1}$

III-4

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.95 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.91 (s, 3H), 6.84 (s, 1H), 7.37 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 8.9

Hz, 2H)

【0117】

III-5

mp 140-141 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.21 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.48 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 7.40 (d,J = 8.9 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 8.9 Hz, 2H)

IR (KBr) 1446, 1426, 1409, 1370, 1362, 1184, 1153, 1029, 973, 920, 870, 849, 776 $cm^{-1}$

III-6

東京化成製

【0118】

III-7

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ: 3.51 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 6.05 (s, 2H), 6.92 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.02 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.18 (s, 1H), 10.40 (s, 1H)

IR (KBr) 1691, 1600, 1577, 1474, 1447, 1422, 1388, 1352, 1252, 1237, 1227, 1201, 1134, 1124, 1082, 1038 $cm^{-1}$

III-8

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.20 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 6.86 (s, 1H), 6.98 (s, 1H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.51-7.56 (m, 2H)

【0119】

III-9

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.20 (s, 3H), 3.34 (s, 3H), 7.37-7.47 (m, 3H), 7.53-7.63 (m, 3H), 7.71 (d, J = 2.1Hz, 1H)

III-10

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.76 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 6.85 (s, 1H), 6.97 (s, 1H), 7.08-7.15 (m, 2H), 7.42-7.49 (m, 2H)

【0120】

III-11

oil

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.72 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 7.05-7.16 (m, 2H), 7.24-7.50 (m, 2H).

IR ($CHCl_3$) 1511, 1477, 1369, 1267, 1121, 1100, 1077, 1010., 970, 942, 813 $cm^{-1}$

III-12

oil

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.51 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.86 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 5.28 (s, 2H), 6.65 (s, 1H), 6.97&7.47 (ABq, J = 8.6 Hz, 4H)

【0121】

III-13

mp 120-122 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.20 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 5.28 (s, 2H), 6.63 (s, 1H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.56-7.61 (m, 2H)

IR (KBr) 1505, 1468, 1427, 1375, 1237, 1175, 1153, 1100, 1072, 1003, 972 $cm^{-1}$

III-14

mp 146-147 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.85 (s, 3H), 6.94-7.01 (m, 2H), 7.38-7.56 (m, 6H)

IR (KBr) 1603, 1522, 1481, 1288, 1255, 1036 $cm^{-1}$

【0122】

III-15

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.07 (s, 6H), 3.49 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 6.95 (brs, 2H), 7.20 (s, 1H)7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 10.42 (s, 1H)

III-16

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.48 (s, 3H), 3.50 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 6.81 (s, 1H), 7.70 (s, 4H)

III-17

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.24 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 7.21 (s, 1H)

, 7.42 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.65 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 10.41 (s, 1H)

【0123】

I-1

mp 155.5-156 ℃

$^1$H NMR (acetone-$d_6$) δ 1.77 (br s, 3H), 1.79 (br s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.63 (br d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.52 (m, 1H), 6.49 (1H, s), 6.83 (dd, J = 2.2 and 8.2 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.94 (m, 2H), 6.96 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.62 (br s, 1H), 7.78 (s, 1H), 8.64 (br s, 1H)

IR (KBr) 3393, 2932, 1611, 1588, 1522, 1490, 1117, 1071, 1001 $cm^{-1}$

I-2

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.67 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.15 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.30-7.50 (m, 9H), 7.60-7.75 (m, 2H)

IR (KBr) 1373, 1361, 1179, 1149, 1079, 874, 799 $cm^{-1}$

【0124】

I-3

mp 155-157 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.43- 5.55 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.30-7.42 (m, 4H), 7.65-7.75 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1481, 1364, 1179, 1153, 1083, 970, 877, 796 $cm^{-1}$

I-4

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 6.44 (s, 1H), 6.92-7.19 (m, 5H), 7.34-7.44 (m, 5H), 7.57- 7.66 (m, 2H)

IR (KBr) 3538, 3510, 3460, 3330, 1605, 1521, 1490, 1455, 1247, 1220, 1120, 1070, 1010 $cm^{-1}$

【0125】

I-5

mp 136-138 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.33-7.49 (m, 7H), 7.55-7.69 (m, 2H), 7.82-7.87 (m, 2H).

IR (KBr) 3433, 2937, 1609, 1519, 1474, 1463, 1364, 1322, 1295, 1274, 1235, 1183, 1167, 1120, 1095, 1077, 1016 $cm^{-1}$

I-6

foam

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.50 (m, 1H), 6.86 (s, 1H), 7.10 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.55-7.69 (m, 2H), 7.82-7.87 (m, 2H).

IR ($CHCl_3$) 3030, 1608, 1518, 1480, 1369, 1322, 1269, 1230, 1179, 1131, 1120, 1097, 1081, 1015 $cm^{-1}$

【0126】

I-7

mp 92-94 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.62 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.31 (m, 1H), 5.71 (s, 1H), 5.85 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 6.93 (dd, J = 1.8, 8.7 Hz, 1H), 6.97 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.55-7.65 (m, 2H), 7.83-7.91 (m, 2H).

IR (KBr) 3466, 2939, 1609, 1587, 1518, 1498, 1486, 1464, 1437, 1406, 1361, 1324, 1245, 1216, 1155, 1125, 1073 $cm^{-1}$

I-8

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.22 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.74 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.93 (s, 1H), 7.01 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.32-7.48 (m, 9H), 7.73 (d, J = 9.0 Hz, 2H)

IR (KBr) 3400, 1721, 1612, 1509, 1471, 1362, 1242, 1153, 1040, 1018 $cm^{-1}$

【0127】

I-9

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.03 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 2.16 (dq, J = 7.2, 6.0 Hz, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.68 (d, J = 5.4 Hz, 2H), 5.70 (m, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.07 (br s, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-10

mp 174-175 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.11 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.49 (br s, 2H), 5.18 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.15 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 8.4 Hz, J = 2.1 Hz, 1H), 7.35-7.49 (m, 8H), 7.70 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1467, 1360, 1346, 1331, 1295, 1272, 1229, 1180, 1151, 1122, 1101, 1081, 1022, 980, 971, 954, 875, 849, 814, 798, 742, 525 $cm^{-1}$

【0128】

I-11

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.22 (s, 6H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.49 (br s, 2H), 4.64 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 5.45-5.55 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 8.7 and 2.1 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.36-7.41 (m, 2H), 7.65-7.75 (m, 2H)

IR (KBr) 3553, 3434, 1516, 1472, 1365, 1176, 1150, 973, 871 $cm^{-1}$

I-12

$^1H$ NMR (DMSO-$d_6$) δ 1.72 (s, 3H), 1.77 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.20 (br s, 2H), 4.47 (br t, J = 4.4 Hz, 1H), 4.55 (br d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.40-5.57 (m, 1H), 6.64 (dd, J = 8.2, 2.0 Hz, 1H), 6.70 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.75-7.00 (m, 4H), 7.40-7.55 (m, 2H)

IR (KBr) 3435, 1518, 1475, 1459, 1261, 1223, 988 $cm^{-1}$

【0129】

I-13

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.71 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 5.67 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 6.89-6.96 (m, 2H), 7.00 (m, J = 1.8 Hz, 1H), 7.32-7.50 (m, 7H), 7.70 (d, J = 9.0 Hz, 2H)

I-14

mp 140-141 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.71 (s, 3H), 2.83 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 6.90 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.30-7.50 (m, 9H), 7.70 (d, J = 8.9 Hz, 2H)

IR (KBr) 1642, 1516, 1467, 1362, 1180, 1151, 1118, 1050, 867, 803, 708 $cm^{-1}$

I-15

mp 161-162 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.61 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.49 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.90 (S, 1H), 7.02 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.31-7.37 (m, 2H), 7.38 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.70 (d, J = 8.9 Hz, 2H)

IR (KBr) 1643, 1516, 1467, 1362, 1277, 1236, 1180, 1150, 974, 882, 868, 847, 802, 710 $cm^{-1}$

【0130】

I-16

mp 206-207 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.71 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.62 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 3.27 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 4.53 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 5.47 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.61 (dd, J = 8.3 and 2.1 Hz, 1H), 6.71 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.87 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 8.83 (br s, 1H), 9.59 (br s, 1H)

IR (KBr) 3427, 3020, 1608, 1517, 1467, 1379, 1233, 1053, 1005, 839, 799,

759, 543 $cm^{-1}$

I-17

mp 171-172 ℃

$^1H$ NMR (DMSO-$d_6$) δ 1.74 (d, J = 0.9 Hz, 3H), 1.77 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.65 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.48 (m, 1H), 7.06-7.27 (m, 4H), 7.48&7.74 (ABq, J = 9.0 Hz, 4H)

IR (KBr) 1523, 1483, 1394, 1366, 1271, 1175, 1151, 1087, 1071, 872, 861, 847, 796 $cm^{-1}$

I-18

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.80 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.99 (s, 1H), 5.48-5.62 (m, 1H), 6.00 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.88-6.97 (m, 2H), 7.04 (dd, J = 9.0, 9.0 Hz, 1H), 7.15-7.29 (m, 2H), 7.45-7.60 (m, 2H)

IR (KBr) 3393, 1523, 1490, 1466, 1403, 1267, 1229, 1113, 1070 $cm^{-1}$

【0131】

I-19

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.56 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 5.76 (s, 1H), 6.92 (dd, J = 8.4 and 2.0 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.35-7.51 (m, 7H), 7.60 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

I-20

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.69 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 7.18 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 9H), 7.59 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-21

mp 94-95 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.73 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 4.65 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.50 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 8.6 and 2.1 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 2.

1 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 8.8 Hz, 2H)

IR (KBr) 1516, 1367, 1180, 1152, 1039, 975, 869, 799 $cm^{-1}$

【0132】

I-22

mp 148-150 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.42 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 4.98 (br s, 1H), 5.53 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 6.92 - 6.96 (m, 4H), 7.07 (s, 1H), 7.43 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

IR (KBr) 3398, 1612, 1587, 1523, 1462, 1410, 1261, 1211, 1099, 1036, 984, 952, 919, 838, 815 $cm^{-1}$

I-23

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.28 (t, J = 6.3Hz, 1H), 2.60 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.78 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 5.18 (s, 2H), 6.84(s, 1H), 7.06 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.29-7.48 (m, 9H), 7.69 (d, J = 8.7Hz, 2H)

I-24

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.50 (s, 3H), 3.21(s, 3H), 3.56(s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.57 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 5.51 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.92 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.17-7.29 (m, 2H), 7.36 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.70 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3434, 1608, 1512, 1479, 1364, 1234, 1175, 1150, 1078, 1017 $cm^{-1}$

【0133】

I-25

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.75 (s, 3H), 1.80 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.57 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 4.95 (s, 1H), 5.53 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 5.86 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.53 (d, J=8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3399, 1612, 1566, 1581, 1520, 1486, 1237, 1115, 1078, 1001 $cm^{-1}$

I-26

mp 246-247 ℃

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 5.16 (s, 3H), 6.84-6.87 (m, 2H), 7.05 (s, 2H), 7.14 (s, 1H), 7.32-7.43 (m, 3H), 7.49-7.64 (m, 8H)

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1594, 1453, 1387, 1296, 1253, 1010 $cm^{-1}$

I-27

$^1$H NMR(DMSO-$d_6$) δ 3.38 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 5.28 (s, 2H), 7.36-7.54 (m, 8H), 7.69-7.86 (m, 8H)

IR (KBr) 1488, 1354, 1286, 1178, 1151, 1116 $cm^{-1}$

【0134】

I-28

mp 162-163 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.25-5.48 (m, 1H), 7.09 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.36-7.40 (m, 2H), 7.52 (dd, J = 2.4, 9.0 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.62 (s, 4H), 7.63-7.69 (m, 2H)

IR (KBr) 1489, 1363, 1290, 1177, 1154, 1115, 971, 860, 809 $cm^{-1}$

I-29

mp 195 ℃

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 1.72 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 4.57 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 5.45-5.50 (m, 1H), 6.84-6.87 (m, 2H), 6.98-7.11 (m, 3H), 7.50-7.64 (m, 6H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1609, 1594, 1497, 1257, 991 $cm^{-1}$

I-30

mp 145-148 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.60-2.20 (m, 6H), 2.72 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.92 (m, 1H), 5.88 (m, 1H), 6.02 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.12 (d, J = 8.6Hz, 1H), 7.34-7.40 (m, 4H), 7.69 (m, 2H)

IR (KBr) 1517, 1481, 1390, 1362, 1270, 1244, 1180, 1151, 1077, 1012, 973, 960, 873, 817, 799, 521 $cm^{-1}$

【0135】

I-31

mp 108-110 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.60-2.20 (m, 6H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.86 (m, 1H), 5.02 (b s, 1H), 5.75 (s, 1H), 5.90 (m, 1H), 5.91 (s, 1H), 6.00 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.90-7.07 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3485, 1614, 1523, 1491, 1457, 1407, 1312, 1287, 1269, 1238, 1195, 1170, 1115, 1072, 1014 $cm^{-1}$

I-32

mp 188-190 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.69 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.26 (s,3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.84 (m, 2H), 6.42 (dt, J = 15.6 Hz, J = 5.7 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 15.6 Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.15 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.28-7.43 (m, 9H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1479, 1447, 1391, 1360, 1301, 1273, 1241, 1228, 1201, 1175, 1152, 1120, 1079, 1014, 974, 959, 947, 868, 819, 795, 777, 743, 521 $cm^{-1}$

I-33

mp 157-159 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.81 (m, 2H), 4.93 (b s, 1H), 5.70 (s, 1H), 5.91 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.46 (dt, J = 15.9 Hz, J = 6.0 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 15.9 Hz, 1H), 6.90-7.09 (m, 5H), 7.26-7.46 (m, 5H), 7.54 (m, 2H)

IR (KBr) 3466,1611,1522,1489, 1461, 284, 1248, 1192, 1165, 1114, 1073 $cm^{-1}$

【0136】

I-34

mp 127-129 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.03 and 1.04 (both t, both J = 8.0 Hz, total 3H), 2.07-2.19 (m, 2H), 2.71 and 2.72 (both s, total 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.60 and 4.71 (both m, total 2H), 5.66-5.75 and 5.90-5.99 (both m, total 2H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.33-7.41(m, 4H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1482, 1390, 1362, 1232, 1180, 1150, 1077, 974, 873, 815, 799, 522 $cm^{-1}$

I-35

mp 166-168 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.04 and 1.05 (both t, both J = 7.5 Hz, total 3H), 2.09-2.19 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.58 and 4.68 (both m, total 2H), 5.01 (b s, 1H), 5.69-5.78 and 5.87-5.95 (both m, total 4H), 6.45 (s, 1H), 6.90-7.06 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3531, 3489, 3306, 1523, 1492, 1459, 1408, 1314, 1287, 1270, 1255, 1234, 1224, 1118, 1072, 1018, 1005, 822 $cm^{-1}$

I-36

mp 148-150 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.62 (s, 3H), 1.69 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.08-2.20 (m, 4H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.66 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 5.09 (m, 1H), 5.50 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.33-7.41 (m, 4H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1480, 1464, 1449, 1389, 1366, 1291, 1271, 1233, 1200, 1176, 1150, 1118, 1079, 1012, 973, 946, 876, 841, 816, 801, 523, 510 $cm^{-1}$

【0137】

I-37

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.58 (s, 3H), 1.63 (s, 3H), 1.70 (s, 3H), 2.05-2.20 (m, 4H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 4.95 (b s, 1H), 5.11 (m, 1H), 5.53 (m, 1H), 5.70 (s, 1H) , 5.90 (s, 1H), 6.45 (s, 1

H), 6.91-7.08 (m, 5H), 7.54 (m, 2H)

I-38

mp 149-151 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.68 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.55 (m, 2H), 2.73 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.07 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 5.21 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.32-7.40 (m, 4H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1520, 1483, 1389, 1363, 1296, 1180, 1151, 1079, 975, 872, 815, 799, 521 $cm^{-1}$

I-39

mp 105-107 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.68 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 2.53 (m, 2H), 3.54 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.06 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 5.01 (b s, 1H), 5.22 (m, 1H), 5.69 (s, 1H), 5.90 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.90-7.06 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3477, 3388, 1523, 1489, 1469, 1402, 1285, 1261, 1248, 1227, 1196, 1175, 1164, 1115, 1100, 1073, 1011 $cm^{-1}$

【0138】

I-40

mp 155-157 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.89 (t, J = 2.4 Hz, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.74 (q, J = 2.4 Hz, 2H), 5.00 (b s, 1H), 5.66 (s, 1H), 5.92 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.90-7.08 (m, 5H), 7.54 (m, 2H)

IR (KBr) 3446, 2224, 1523, 1488, 1402, 1266, 1238, 1203, 1187, 1166, 1102, 1068, 1009 $cm^{-1}$

I-41

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.19 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.62 (m, 2H), 4.92 (b s, 1H), 5.60 (bs, 1H), 5.92 (s, 1H), 5.99 (m, 1H), 6.45 (m,1H), 6.91-7.08 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

I-42

oil

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 3.22 (s, 6H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.66 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 5.61 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.37-7.41 (m, 3H), 7.61 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67 (m, 2H)

【0139】

I-43

mp 132-136 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.74 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.62 (m, 2H), 5.05 (br s, 1H), 5.61 (m, 1H), 5.79 (s, 1H), 6.02 (s, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.92 (m, 2H), 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3495, 3422, 1611, 1520, 1473, 1400, 1355, 1315, 1280, 1227, 1194, 1173, 1111, 1077, 1023 $cm^{-1}$

I-44

mp 148-149 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.60 (s, 3H),1.70 (s, 3H), 2.32-2.39 (m, 2H), 2.65 (s, 3H), 2.76-2.81 (m, 2H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.16-5.21 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.30-7.40 (m, 5H), 7.66-7.71 (m, 2H)

IR (KBr) 1480, 1390, 1361, 1181, 1150, 1075 $cm^{-1}$

I-45

mp 73-75 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.63 (s, 3H), 1.72 (s, 3H), 2.32-2.39 (m, 2H), 2.64-2.70 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.83 (s, 1H), 4.95 (s, 1H), 5.27-5.31 (m, 1H), 5.92 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.89-7.00 (m, 4H), 7.21 (d, J = 10.5 Hz,1H), 7.52-7.55 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 3100-2800 (br), 1612, 1579, 1523, 1487, 1452, 1400, 1360, 1226, 1174, 1111, 1072 $cm^{-1}$

【0140】

I-46

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.65 (m, 2H), 4.85 (s, 1H), 5.33 (m, 1H), 5.44 (m, 1H), 5.67 (s, 1H), 5.91 (s, 1H), 6.10 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (m, 2H), 6.95 (m, 2H), 7.08 (m, 1H), 7.54 (m, 2H)

I-47

$^1$H NMR (acetone-$d_6$) δ 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.48 (s, 1H), 6.83 (dd, J = 2.0 Hz, J = 8.4 Hz, 1H), 6.93 (m, 2H), 6.96 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.34-7.45 (m, 3H), 7.52 (m, 2H), 7.52-7.58 (m, 2H)

IR ($CHCl_3$) 3522, 3348, 1699, 1612, 1589, 1521, 1489, 1458, 1402, 1288, 1114, 1071, 935 $cm^{-1}$

I-48

$^1$H NMR (acetone-$d_6$) δ 1.28 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.25 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 4.78 (s, 2H), 6.49 (s, 1H), 6.83 (dd, J = 1.8 and 8.4 Hz, 1H), 6.93 (m, 2H), 6.96 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.97 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.63 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 8.50 (s, 1H)

【0141】

I-49

$^1$H NMR (acetone-$d_6$) δ 1.75 (m, 3H), 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.56 (m, 2H), 5.71-5.82 (m, 1H), 5.84-5.96 (m, 1H), 6.48 (s, 1H), 6.82 (dd, J = 2.0 and 8.4 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.93 (m, 2H), 6.95 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.52 (m, 2H)

I-50

$^1$H NMR (acetone-$d_6$) δ 1.75 (m, 3H), 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.72 (m, 2H), 5.73-5.75 (m, 2H), 6.48 (s, 1H), 6.83 (dd, J = 2.0 and 7.8 Hz, 1H), 6.92-6.95 (m, 3H), 6.97 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.52 (m, 2H)

I-51

$^1$H NMR (acetone-$d_6$) δ 1.77 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.72 (s

, 3H), 4.66 (m, 2H), 5.53 (m, 1H), 6.49 (s, 1H), 6.85 (m, 2H), 7.04 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.10 (dd, J = 2.1 and 8.1Hz, 1H), 7.19 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.25 (m, 2H)

【0142】

I-52

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.58 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 2.73 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.26 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.83 (d, J = 2.2 Hz, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.35-7.46 (m, 4H), 7.64-7.74 (m, 2H)

I-53

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.36 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.55 (s, 2H), 4.76 (dd, J = 1.8 and 0.6 Hz, 1H), 5.02 (br s, 1H), 5.97 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.90-6.96 (m, 2H), 6.96-7.05 (m, 2H), 7.10-7.12 (m, 1H), 7.50-7.58 (m, 2H)

I-54

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.61 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.61 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.17 (br s, 1H), 5.45-5.50 (m, 1H), 5.72 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.88-7.00 (m, 4H), 7.02 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.50-7.57 (m, 2H)

【0143】

I-55

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 0.99 (d, J = 6.5 Hz, 6H), 1.74 (q, J = 6.5 Hz, 2H), 1.85 (m, 1H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.12 (t, J = 6.5 Hz, 2H), 4.97 (s, 1H), 5.65 (s, 1H), 5.90 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (m, 2H), 6.95 (m, 2H), 7.06 (m, 1H), 7.54 (m, 2H)

I-56

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.34 (s, 3H), 1.35 (s, 3H), 3.15 (dd, J = 3.6 and 6.6 Hz, 1H), 3.39 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.10 (dd, J = 6.6 and 11.1 Hz, 1H), 4.34 (dd, J = 3.6 and 11.1 Hz, 1H), 6.49 (s, 1H), 6.83 (dd, J = 1.8 and 8.1 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.94 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.00 (

d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-57

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.78(s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 7.10-7.19 (m, 3H), 7.31-7.50 (m, 7H), 7.57-7.64 (m, 2H)

IR (KBr) 1607, 1520, 1481, 1373, 1231, 1176, 1119, 1078 $cm^{-1}$

【0144】

I-58

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.53(s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 6.84 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 5.83 (s, 1H), 7.06-7.20 (m, 3H), 7.31-7.40 (m, 2H), 7.56-7.65 (m, 2H)

IR (KBr) 1603, 1521, 1483, 1376, 1366, 1176, 1085 $cm^{-1}$

I-59

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.62 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.52 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 5.71 (br s, 1H), 5.89 (s,1H), 6.44 (s, 1H), 6.90-719 (m, 5H), 7.56-7.67 (m, 2H)

IR (KBr) 3545, 3385, 1605, 1586, 1561, 1520, 1384, 1311, 1284, 1225, 1121, 1096 $cm^{-1}$

I-60

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.49 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.68 (s, 1H), 5.91 (s, 1H), 6.02 (s, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.88-7.19 (m, 6H), 7.31-7.48 (m, 5H)

IR ($CHCl_3$) 3535, 1615, 1588, 1519, 1500, 1482, 1410, 1290, 1241, 1204, 1092, 1041 $cm^{-1}$

【0145】

I-61

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s ,3H), 1.81 (s, 3H), 2.73 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 5.50 (t, J = 6.6

Hz, 1H), 6.03 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.14 (s, 1H), 7.34 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.39 (s, 1H)

IR ($CHCl_3$) 1607, 1518, 1477, 1453, 1369, 1240, 1178, 1081 $cm^{-1}$

I-62

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.49 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.61 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.53 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 5.68 (s, 1H), 6.02 (s, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.88-6.96 (m, 3H), 7.03-7.18 (m, 3H)

IR (KBr) 3494, 1610, 1583, 1561, 1519, 1480, 1460, 1409, 1286, 1243, 1191, 1127, 1089, 1036 $cm^{-1}$

I-63

mp 201-202 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.78 (s, 6H), 5.16 (s, 4H), 5.69 (s, 2H), 6.93 (s, 2H), 6.99 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.08 (dd, J = 2.1 and 8.4 Hz, 2H), 7.22 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 7.37-7.47 (m, 10H),

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1584, 1523, 1454, 1272, 1245, 1210, 1130 $cm^{-1}$

【0146】

I-64

mp 173-175 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.12 (s, 6H), 3.80 (s, 6H), 5.18 (s, 4H), 6.92 (s, 2H), 7.12 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.36-7.50 (m, 12H), 7.60 (d, J = 2.1 Hz, 2H)

IR (KBr) 1523, 1492, 1356, 1290, 1263, 1210, 1182, 1114 $cm^{-1}$

I-65

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (d, J = 0.9Hz, 6H), 1.81 (d, J = 0.6 Hz, 6H), 3.22 (s, 6H), 3.80 (s, 6H), 4.63 (d, J = 6.6Hz, 4H), 5.48-5.53 (m, 2H), 6.92 (s, 2H), 7.05 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.48 (dd, J = 2.1 and 8.4 Hz, 2H), 7.57 (d, J = 2.1 Hz, 2H)

IR (KBr) 1523, 1492, 1468, 1353, 1286, 1258, 1213, 1174, 1108 $cm^{-1}$

I-66

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 6H), 1.82 (s, 6H), 3.78 (s, 6H), 4.62 (d, J = 6.9 Hz,4H), 5.50-5.55 (m, 2H), 5.71 (s, 2H), 6.91-6.94 (m, 4H), 7.08 (dd, J = 2.1 and 8.4 Hz, 2H), 7.57 (d, J = 2.1 Hz, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1523, 1492, 1271, 1242, 1210, 1186, 1034 $cm^{-1}$

【0147】

I-67

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.28 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.48-5.53 (m, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.06 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.13 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.42-7.51 (m, 3H), 7.57 (d, J = 2.1 Hz, 1H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1525, 1493, 1362, 1293, 1210, 1172, 1107 $cm^{-1}$

I-68

mp 168-169 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.18 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 5.71 (s, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.96 (s, 1H), 6.99 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.08 (dd, J = 2.1 and 8.7 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.26-7.48 (m, 7H)

IR(KBr) 3600-3200 (br), 1488, 1382, 1369, 1269, 1206, 1174, 1146 $cm^{-1}$

I-69

mp 155-157 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.12 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.80 (s, 6H), 5.18 (s, 2H), 6.92 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.12 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.32-7.51 (m, 8H), 7.60-7.65 (m, 3H)

IR (KBr) 1491, 1363, 1210, 1174, 1151, 1114 $cm^{-1}$

【0148】

I-70

mp 109-110 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.80 (s, 6H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.05-5.30 (m, 1H), 6.92 (s, 1

H), 6.95 (s, 1H), 7.06 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.33-7.37 (m, 2H), 7.49 (dd, J = 2.1 and 8.7 Hz, 1H) 7.58 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.61-7.64 (m, 2H)
IR (KBr) 1522, 1489, 1368, 1351, 1294, 1260, 1212, 1178, 1149, 1114, 975 $cm^{-1}$

I-71
$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.56 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.46-5.49 (br s,1H), 6.79-6.82 (m, 2H), 6.88-7.01 (m, 5H), 7.34-7.39 (m, 2H), 8.89 (s, 1H), 9.45 (s, 1H)
IR (KBr) 3600-3100 (br), 1524, 1493, 1458, 1386, 1261, 1206, 1010 $cm^{-1}$

I-72
mp 123-124 ℃
$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.80 (s, 6H), 4.64 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.52-5.57 (m, 1H), 6.93 (s, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.04 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.26-7.39 (m, 3H), 7.60-7.65 (m, 2H)
IR (KBr) 1524, 1494, 1463, 1379, 1265, 1211, 1174, 1154, 1130 $cm^{-1}$

【0149】

I-73
mp 118-119 ℃
$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 4.86 (s, 1H), 5.52-5.57 (m, 1H), 6.88-6.93 (m, 4H), 7.03 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.26-7.29 (m, 1H), 7.37 (dd, J = 2.4 and 12.9 Hz, 1H), 7.40-7.50 (m, 2H)
IR (KBr) 3600-3100 (br), 1525, 1492, 1466, 1381, 1263, 1206 $cm^{-1}$

I-74
$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.63 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 5.74 (s, 1H), 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 2.1 and 8.4 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.36-7.68 (m, 12H)
IR (KBr) 3700-3200 (br), 1486, 1367, 1353, 1197, 1179, 1147 $cm^{-1}$

I-75

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.80 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 7.18 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38-7.68 (m, 14H)

IR (KBr) 1485, 1361, 1186, 1156, 1107 $cm^{-1}$

【0150】

I-76

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.78 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.81(s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.26 (s, 3H), 4.65 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 5.47-5.52 (m, 1H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.37-7.67 (m, 9H)

IR (KBr) 1486, 1365, 1186, 1154, 1106, 973, 926, 870, 810 $cm^{-1}$

I-77

mp 174-176 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 4.55 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 5.45-5.49 (m, 1H), 6.82-7.43 (m, 10H), 8.84 (s, 1H), 9.45 (s, 1H), 9.53 (s, 1H)

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1610, 1594, 1532, 1496, 1444, 1409, 1305, 1245, 1209 $cm^{-1}$

I-78

mp 134-135 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 5.70 (s, 1H), 6.91 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 6.99 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.07-7.14 (m, 3H), 7.22 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.36-7.47 (m, 5H), 7.52-7.57 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3100 (br), 1524, 1494, 1462, 1381, 1273, 1248, 1213 $cm^{-1}$

【0151】

I-79

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.12 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 6.92 (s, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.09-7.15 (m, 3H), 7.38-7.56 (m, 8H), 7.60 (d, J = 2.1 Hz, 1H)

IR (KBr) 1522, 1493, 1467, 1387, 1365, 1279, 1213, 1112 $cm^{-1}$

I-80

mp 110-111 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.50-5.57 (m, 1H), 6.91 (s, 1H), 6.94 (s, 1H), 7.04-7.14 (m, 3H), 7.47-7.58 (m, 4H)

IR (KBr) 1552, 1493, 1364, 1212, 1110, 970 $cm^{-1}$

I-81

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.62 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.50-5.55 (m, 1H), 5.72 (s, 1H), 6.91-6.95 (m, 3H), 7.06-7.14 (m, 3H), 7.20 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.52-7.57 (m, 2H)

IR(KBr) 3536, 1520, 1493, 1386, 1271, 1241, 1210 $cm^{-1}$

【0152】

I-82

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.29 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 3.78 (s, 6H), 3.78 (q, 2H), 4.64 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 4.72 (s, 2H), 5.53-5.78 (m, 1H), 6.61 (s, 1H), 6.94 (s, 1H), 6.98 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.09-7.20 (m, 4H), 7.52-7.57 (m, 2H)

IR (KBr) 1758, 1524, 1496, 1461, 1387, 1263, 1209, 1147 $cm^{-1}$

I-83

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.76 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77(s, 3H), 5.26 (s, 2H), 6.85(s, 1H), 7.17 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 8H), 7.60-7.71 (m, 3H), 7.92 (s, 1H)

IR (KBr) 1684, 1606, 1512, 1478, 1177, 1150, 1080, 1016 $cm^{-1}$

I-84

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.26 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 3.08 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.16 (q, J = 7.2Hz, 2H), 5.17 (s, 2H), 6.44 (d, J = 16.5Hz, 1H), 6.89 (s, 1H), 7.13 (s, 2H), 7.27 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.35-7.50 (m, 8H), 7.69 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1708, 1633, 1513, 1465, 1367, 1271, 1230, 1176, 1151, 1120, 101

THIS PAGE BLANK (USPTO)

7 $cm^{-1}$

【0153】

I-85

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.26 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.16 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.70(s, 1H), 6.53 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 6.69 (dd, J = 8.4 and 2.4 Hz, 1H), 6.88 (s, 2H), 7.00 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.33-7.50 (m, 8H), 7.70 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 3398, 1675, 1627, 1581, 1512, 1465, 1370, 1284, 1256, 1221, 1148, 1074, 1017 $cm^{-1}$

I-86

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.53 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.77(s, 3H), 4.58 (s, 2H), 5.24 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.96 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.28-7.57 (m, 9H), 7.69 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1605, 1512, 1479, 1366, 1233, 1175, 1149, 1080, 1015 $cm^{-1}$

I-87

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.27 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.40-5.50 (m, 1H), 5.71 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 6.91-6.95(m, 3H), 7.05-7.20 (m, 3H), 7.43-7.51 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1617, 1525, 1494, 1464, 1361, 1292, 1208, 1178, 1101, 1033 $cm^{-1}$

【0154】

I-88

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.57 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.06-7.15 (m, 1H), 7.20-7.40 (m, 9H), 7.47-7.57 (m, 2H), 7.60-7.75 (m, 3H), 8.20-8.25 (m, 2H)

I-89

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.01 (s, 1H), 5.18 (s, 2H), 6.01 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.88-6.97 (m, 2H), 7.07 (dd, J = 8.4 and 8.4 Hz, 1H), 7.15-7.21 (m, 1H), 7.27 (dd, J = 12.3 and 2.1 Hz, 1H), 7.29-

7.43 (m, 3H), 7.45-7.56 (m, 4H)

I-90

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.68 (s, 3H), 1.75 (d, J = 0.9 Hz, 3H), 2.55 (dt, J = 6.9 and 6.9 Hz, 2H), 2.70 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.04 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 5.17-5.28 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.04 (dd, J = 8.4 and 8.4 Hz, 1H), 7.11-7.22 (m, 2H), 7.34-7.42 (m, 2H), 7.65-7.75 (m, 2H)

IR (KBr) 1522, 1483, 1361, 1352, 1176, 1156, 1079, 963, 873, 801 $cm^{-1}$

【0155】

I-91

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.96 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 3.58 (s, 6H), 3.73 (s, 3H), 4.89 (s, 2H), 5.19 (s, 2H), 5.23 (s, 2H), 5.25 (s, 2H), 6.68 (s, 1H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 8.4 and 2.1 Hz, 1H), 7.11 (m, 2H), 7.25 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.30-7.40 (m, 5H), 7.51 (m, 2H)

IR (KBr) 2952, 2935, 2896, 1609, 1521, 1477, 1463, 1438, 1383, 1269, 1249, 1228, 1183, 1153, 1130, 1116, 1078, 1066, 1020, 1008, 984, 944, 922, 903, 832, 801, 730 $cm^{-1}$

I-92

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.53-3.90 (m, 2H), 3.60 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.80-3.83 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.68 (s, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.92-7.02 (m, 4H), 7.07 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.38-7.48 (m, 5H), 7.51-7.56 (m, 2H)

I-93

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.59 (dt, J = 6.6, 6.6 Hz, 2H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.15 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 5.15 (dm, J = 10.2 Hz, 1H), 5.21 (dm, J = 17.1 Hz, 1H), 5.90 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.95 (s, 2H), 7.06 (br s, 1H), 7.53 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (Nujol) 3570, 3525, 3336, 3205, 1616, 1596, 1524, 1493, 1409, 1315, 1286, 1264, 1239, 1225, 1117, 1072, 821, 783 $cm^{-1}$

【0156】

I-94

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 0.36 (m, 2H), 0.66 (m, 2H), 1.31 (m, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.91 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 6.44 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.93 (m, 2H), 7.07 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (Nujol) 3570, 3491, 3364, 3178, 1617, 1598, 1583, 1524, 1494, 1408, 1313, 1285, 1266, 1240, 1224, 1115, 1072, 1011, 822, 786 $cm^{-1}$

I-95

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.86 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.54 (s, 2H), 5.04 (br s, 1H), 5.12 (br s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.95 (m, 2H), 7.08 (brs, 1H), 7.53(d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (Nujol) 3536, 3364, 3179, 1614, 1586, 1524, 1493, 1407, 1309, 1284, 1265, 1238, 1226, 1115, 1073, 1011, 887, 821, 782 $cm^{-1}$

I-96

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.58 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.79 (d, J = 2.4 Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.98 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (Nujol) 3410, 3282, 1612, 1589, 1523, 1489, 1404, 1226, 1114, 1071, 1015, 826 $cm^{-1}$

【0157】

I-97

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.47 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.00 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.6, 2.0 Hz, 1H),7.38 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.46 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.67 (m, 1H), 7.68 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.99 (m, 2H)

I-98

mp 200-203 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.38 (s, 3H), 2.67 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.34 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.34 (dd, J = 8.7, 2.4 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.40 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (Nujol) 1608, 1520, 1480, 1359, 1173, 1156, 1078, 1016, 976, 948, 872, 818, 791 $cm^{-1}$

I-99

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.72 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.12 (dd, J = 8.7, 7.2 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.40 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.45 (dd, J = 8.7, 5.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

【0158】

I-100

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.76 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.25 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.13 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-101

mp 103-105 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.18 (dd, J = 1.5, 1.2 Hz, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.79 (dd, J = 5.7, 1.2 Hz, 2H), 5.81 (dt, J = 5.7, 1.5 Hz, 2H), 6.45 (s,1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.95 (s, 1H), 6.96 (s, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3527, 3328, 2930, 1614, 1593, 1523, 1492, 1463, 1408, 1262, 1235, 1225, 1119, 1072, 1010, 828, 805 $cm^{-1}$

I-102

mp 95-99 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.67 (s, 2H), 5.47 (m, 1H), 5.55 (dd, J = 2.7,1.2 Hz, 1H), 6.45 (s,1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.01 (m, 2H), 7.04 (d, J =1.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

【0159】

I-103

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.59 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.45 (m, 1H), 6.55 (d, J = 12.9 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.08 (br s, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-104

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.64 (dd, J = 6.0 and 1.2 Hz, 2H), 6.23 (dt, J = 13.2 and 6.0 Hz, 1H), 6.42 (dt, J = 13.2 and 1.2 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.08 ( br s, 1H), 7.58 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-105

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.98 (d-like, J = 7.2 Hz, 1H), 4.64 (d-like, J = 3.9 Hz, 1H), 6.04 (dt, J = 15.3, 4.8 Hz, 1H), 6.06 (1H, dt, J = 15.3, 6.0 Hz, 1H), 6.45(s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.08 (s, 2H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

【0160】

I-106

foam

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.83 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 4.61(d, J = 7.0 Hz, 2H,), 4.94 (s, 1H), 5.54 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 5.70 (s, 1H), 6.70 (dd, J = 8.4, 2.0 Hz, 1H), 6.74 (s, 1H), 6.84 (d, J = 2.0 Hz, 1H)

IR (KBr) 3410, 1520, 1476, 1390, 1243, 1225, 1101, 1084, 834, 812, 775 $cm^{-1}$

I-107

mp 112-114 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.03 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.87 (s, 3H), 4.90 (S, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.63 (br s, 1H), 6.68 (s, 1H), 6.91-7.07 (m, 5H), 7.38-7.51 (m, 5H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3512, 2952, 2936, 1607, 1519, 1468, 1442, 1382, 1284, 1253, 1229, 1215,1185, 1156, 1112, 1079, 1065, 1020, 983, 956, 914, 831 $cm^{-1}$

I-108

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.20 (d, J = 1.2 Hz, 3H), 2.76 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.65 (m, 2H), 5.96 (m, 1H), 7.07 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.34-7.41 (m, 4H), 7.68 (m, 2H)

【0161】

I-109

mp 153-154 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.20 (d, J = 1.5 Hz, 3H), 2.75 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.81 (m, 2H), 5.80 (m, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.34-7.41 (m, 4H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 1519, 1481, 1390, 1364, 1234, 1177, 1150, 1119, 1077, 1011, 969, 945, 876, 816, 799, 521 $cm^{-1}$

I-110

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.68 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 5.11 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.36-7.40 (m, 5H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-111

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.78 (s, 3H), 3.22 (s, 6H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.23 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.44 (br s, 2H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 8.70 (br s, 2H)

【0162】

I-112

1H NMR ($CDCl_3$) δ 2.70 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.33 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.15 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.27 (dd, J = 7.5, 4.2 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 8.4, 2.4 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.62 (br d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.76 (ddd, J = 7.5, 7.5, 1.8 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 4.2 Hz, 1H)

I-113

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.76 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.22 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.17 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.39 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.88 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.64 (br s, 1H), 8.73 (br s, 1H)

I-114

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.10 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.95 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.23 (br d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.34 (br d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (Nujol) 3464, 3344, 1611, 1581, 1523, 1490, 1266, 1113, 1073, 1011, 1000, 821, 782 $cm^{-1}$

【0163】

I-115

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.11 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 8.7, 8.7 Hz, 2H), 7.42 (dd, J = 8.7, 5.4 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-116

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.23 (s, 2H), 6.45 (s, 1H)

, 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.97 (br s, 2H), 7.11 (br s, 1H), 7.31 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (Nujol) 3460, 3359, 1610, 1594, 1522, 1490, 1264, 1164, 1110, 1072, 1008, 877, 824, 781 $cm^{-1}$

I-117

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 5.07 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.95 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 6.96 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.53 (d, J = 9.0 Hz, 2H)

IR (Nujol) 3400, 1612, 1586, 1516, 1488, 1246, 1174, 1113, 1070, 1011, 823 $cm^{-1}$

【0164】

I-118

$^1H$ NMR (DMSO-$d_6$) δ 3.29 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 6.39 (s, 1H), 6.64 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.52 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 8.59 (d, J = 6.0 Hz, 2H)

IR (Nujol) 3473, 3441, 1610, 1582, 1523, 1493, 1404, 1241, 1112, 1074, 1005, 816, 782 $cm^{-1}$

I-119

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.27 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.11 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.36 (br d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.77 (ddd, J = 7.5, 7.5, 1.8 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 5.0 Hz, 1H)

IR (Nujol) 3555, 3467, 3342, 1608, 1597, 1586, 1522, 1466, 1210, 1117, 1080, 1016, 822, 761 $cm^{-1}$

I-120

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.21 (s, 2H), 6.46 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.99 (br s, 2H), 7.11 (br s, 1H), 7.40 (dd, J = 7.5, 5.0 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.83 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 8.64 (br d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.74 (br s, 1H)

IR (Nujol) 3342, 1609, 1586, 1522, 1489, 1253, 1118, 1074, 1010, 827, 782 $cm^{-1}$

【0165】

I-121

mp 166-168 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.77 (d, J = 6.3 Hz, 2H), 6.22 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.7, 1.8 Hz,1H), 7.08 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3474, 3411, 2957, 2930, 1615, 1589, 1569, 1523, 1492, 1407, 1286, 1263, 1230, 1113, 1070, 825 $cm^{-1}$

I-122

mp 190-192 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.56 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 5.73 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.93 (dd, J = 8.1 and 1.9 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.37-7.45 (m, 1H), 7.71 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

IR (KBr) 3512, 1519, 1484, 1367, 1174, 1150, 1078, 957, 870, 798 $cm^{-1}$

I-123

foam

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.08 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 6.95 (s, 1H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.33-7.47 (m, 9H), 7.71 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 13.3-14.5 (br s,1H)

IR(KBr): 3422, 1735, 1702, 1520, 1471, 1366, 1175, 1150, 1118, 971, 954, 863, 807 $cm^{-1}$

【0166】

I-124

mp 258-259 ℃ (dec)

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 3.32 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 5.10 (2H, s), 6.65 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.90 (s, 1H), 6.94 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.30-7.54 (m, 7H), 8.98 (s, 1H), 9.63 (s, 1H)

IR(KBr): 3437, 3157, 1702, 1610, 1590, 1521, 1474, 1464, 1379, 1260, 1245, 1224, 1061, 1014, 952, 834, 793, 748, 698 $cm^{-1}$

I-125

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.75 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.61(d, J = 6.8 Hz, 2H), 5.50 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.02 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 2.3 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.71 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

I-126

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.75 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.59 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.06 (s, 1H), 5.51 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 5.67 (s, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.90-6.93 (m, 3H), 6.98 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 9.0 Hz, 2H)

【0167】

I-127

mp 116-117 ℃

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 3.32 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 4.53 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 5.48 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.65 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.73 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.88 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.47 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 8.84 (s, 1H), 9.62 (s, 1H), 11.9-13.4 (br s, 1H)

IR(KBr): 3446, 1703, 1611, 1593, 1520, 1471, 1380, 1260, 1225, 1081, 997

, 952, 838 $cm^{-1}$

I-128

oil

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.65 (s, 3H), 1.78 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.25 (s, 3H) 3.55 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.77 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 5.53 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.87 (s, 1H), 7.39&7.67 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.70 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 10.36 (s, 1H)

IR ($CHCl_3$) 1691, 1473, 1374, 1230, 1226, 1209, 1178, 1152, 1086, 969, 874, 805 $cm^{-1}$

I-129

oil

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.73 (d, J = 0.9 Hz, 3H), 1.80 (s, 3H), 2.89 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.66 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 4.77 (s, 2H), 5.55 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.39&7.68 (ABq, J = 9.0 Hz, 4H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 2.1 Hz, 1H)

IR ($CHCl_3$) 1475, 1372, 1230, 1178, 1151, 1085, 969, 874 $cm^{-1}$

【0168】

I-130

mp 189-190 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.36 (s, 9H), 2.81 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 6.86 (s, 1H), 7.36-7.42 (m, 3H), 7.54 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.67-7.72 (m, 3H)

IR (KBr) 1472, 1363, 1331, 1179, 1153, 1082, 961, 950, 877, 846, 817, 791, 526 $cm^{-1}$

I-131

mp 147-148 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.95 (s, 3H), 3.18 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.28 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.38-7.44 (m, 7H), 7.67 (m, 2H), 7.75 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 2.1 Hz, 1H)

IR (KBr) 1687, 1512, 1472, 1365, 1352, 1234, 1201, 1180, 1151, 1082, 971, 947, 870, 846, 810, 794, 703, 523 $cm^{-1}$

I-132

mp 122-124 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.68 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.80 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.28 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.62 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 3.78 (s, 3H), 5.31 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.34 (dd, J = 8.1 Hz, J = 1.8 Hz, 1H), 7.39&7.68 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.43 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 1.8 Hz, 1H)

IR (KBr) 1474, 1362, 1180, 1151, 1076, 1014, 968, 944, 870, 816, 799, 521 $cm^{-1}$

【0169】

I-133

mp 87-89 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.73 (d, J = 0.9 Hz, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.54 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 4.78 (s, 2H), 5.30 (s, 1H), 5.61 (m, 1H), 5.67 (s, 1H), 6.01 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92&7.52 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.02 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.1 Hz, 1H)

IR (KBr) 3428, 1612, 1522, 1483, 1458, 1403, 1362, 1334, 1304, 1266, 1226, 1174, 1116, 1083, 1024, 970, 938 $cm^{-1}$

I-134

mp 167-168 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.39 (d, J = 1.2 Hz, 3H), 1.70 (s, 3H), 3.36 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.98 (s, 1H), 5.29 (m, 1H), 5.96 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.93&7.54 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 6.96 (dd, J = 7.8 Hz, J = 1.8 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 7.8 Hz, 1H)

IR (KBr) 3413, 3365, 2931, 1611, 1552, 1520, 1502, 1475, 1455, 1441, 140

2, 1360, 1323, 1262, 1227, 1206, 1182, 1170, 1162, 1114, 1100, 1081, 105
2, 1014, 941, 835, 816, 587, 542 $cm^{-1}$

I-135

m.p 183-184 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.78 (m, 2H)
, 5.99 (m, 1H), 6.44 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.
94 (dd, J = 8.1,1.8 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 1.8
Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3383, 2929, 1699, 1523, 1491, 1405, 1262, 1236, 1206, 1173, 111
6, 1071, 1011, 822 $cm^{-1}$

【0170】

I-136

$^1H$ NMR ($CD_3OD$) δ 1.26 (s, 3H), 1.29 (s, 3H), 3.38 (s, 3H), 3.68 (s, 3H)
, 3.80 (dd, J = 8.4, 2.7 Hz, 1H), 3.96 (dd, J = 9.6, 8.4 Hz, 1H), 4.34 (
dd, J = 9.6, 2.7 Hz, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.80 (dd, J =8.1, 1.8 Hz, 1H), 6
.85 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.86 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 8.1 Hz,
1H), 7.46 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-137

$^1H$ NMR ($CD_3OD$) δ 3.38 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 4.02 (dd, J = 11.0, 3.6 Hz
, 1H), 4.12 (dd, J = 11.0, 1.8 Hz, 1H), 5.48 (dd, J = 3.6, 1.8 Hz, 1H),
6.43 (s, 1H), 6.83-6.87 (m, 3H), 6.85 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.46 (d, J =
8.7 Hz, 2H)

I-138

$^1H$ NMR ($CD_3OD$) δ 3.38 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 4.70 (d, J = 5.4 Hz, 2H),
6.43 (s, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 8.4 Hz, 2H),
6.88 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.4 Hz,
2H), 7.62 (t, J = 5.4 Hz, 1H)

【0171】

I-139

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.92 (s, 3H), 4.75 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 6.0, 1.8 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.58 (t, J = 5.1 Hz, 1H)

I-140

$^1$H NMR ($CD_3OD$) δ 3.38 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 4.51 (s, 2H), 4.71 (d, J = 5.4 Hz, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.87 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.75 (t, J = 5.4 Hz, 1H)

I-141

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.76 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.86 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.94 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.31-7.40 (m, 5H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.65 (t, J = 5.1 Hz, 1H)

【0172】

I-142

$^1$H NMR ($CDCl_3$-$CD_3OD$ 1:1) δ 3.26 (s, 3H), 2.64 (m, 4H), 3.13 (m, 4H), 3.44 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.78 (d, J = 4.5 Hz, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.90 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.12 (t, J = 4.5 Hz, 1H), 7.49(d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-143

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.09 (m, 4H), 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.86 (m, 4H), 4.82 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 6.44 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.98 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (t, J = 4.2 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-144

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.29 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 2.65 (dd, J = 15.9, 6.6 Hz, 1H), 2.81 (dd, J = 15.9, 6.6 Hz, 1H), 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.03 (

dd, J = 11.4, 6.9 Hz, 1H), 4.20 (q, J = 6.9 Hz, 2H), 4.35 (dd, J = 11.4, 2.4 Hz, 1H), 4.66 (ddt, J = 6.9, 6.6, 2.4 Hz, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.92 ( d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96-7.01 (m, 3H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

【0173】

I-145

oil

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.68 (s, 3H), 1.74 (d, J = 0.9 Hz, 3H), 2.55 (m, 2H), 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.04 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 4.97 (br s, 1H), 5.23 (m, 1H), 6.00 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92&7.53 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.02 (m, 1H), 7.17-7.22 (m, 2H)

IR (KBr) 1613, 1525, 1490, 1475, 1463, 1454, 1402, 1304, 1269, 1231, 1112, 1072, 1019, 827 $cm^{-1}$

I-146

mp 256-257 ℃

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 3.35 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.22 (s, 2H), 7.06 (s, 1H), 7.28-7.56 (m, 11H), 7.69 (s, 1H), 7.76 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

IR (KBr): 3479, 3360, 1672, 1517, 1465, 1361, 1339, 1295, 1261, 1228, 1172, 1144, 1118, 1013, 957, 870, 852, 804, 751 $cm^{-1}$

I-147

m.p. 163-164 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.74( s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.58 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 5.50 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 5.80 (s, 1H), 6.37 (s, 1H), 6.86-6.95 (m, 5H), 6.90 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.99 (s, 1H), 7.49 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

IR (KBr): 3533, 3412, 3350, 1655, 1609, 1588, 1519, 1469, 1373, 1274, 1245, 1227, 1131, 1082, 1060, 999, 954, 838 $cm^{-1}$

【0174】

I-148

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.88 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.35 (m, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.24 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.39 (d, J =8.7 Hz, 2H), 7.42-7.46 (m, 5H), 7.65 (d.d, J = 9.0 & 2.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 8.26 (d, J = 2.1 Hz, 1H)

I-149

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.80 (s, 3H), 1.85 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.80 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.76 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.14 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 8.4 Hz, 2H) 7.70 (d.d, J = 8.7 & 2.1Hz, 1H), 8.28 (d, J = 2.1 Hz, 1H)

IR (KBr) 3472, 1707, 1671, 1610, 1520, 1482, 1460, 1426, 1269, 1226, 1119, 1076, 1012 $cm^{-1}$

I-150

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.63 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.62(d, J = 6.3 Hz, 2H), 4.73 (s, 2H), 5.50 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.99 (d, J = 9.0Hz, 1H),7.51-7.42 (m, 9H), 7.70 (d, J = 9.0 Hz, 2H)

IR (KBr) 3432, 1607, 1512, 1479, 1364, 1234, 1176, 1151, 1079, 1016 $cm^{-1}$

【0175】

I-151

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.58 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.61(d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.72 (s, 2H), 5.52 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.36 (d.d, J= 8.4 & 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 3580, 3411, 1611, 1521, 1485, 1464, 1397, 1233, 1113, 1077, 1024, 1001 $cm^{-1}$

I-152

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.50 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.72 (s, 1H), 6.03 (s, 2H), 6.71 (d.d, J=8.4 & 2.1 Hz, 1H), 6.91(d, J = 8.4 Hz, 1H),

6.97 (s, 1H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.07 (s, 1H), 7.09 (d.d, J = 8.4 & 2.1 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 5H), 989 (s, 1H)

IR (KBr) 3446, 1697, 1587, 1511, 1470, 1383, 1285, 1240, 1127, 1036 $cm^{-1}$

I-153

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.87 (s, 1H), 5.16 (s, 2H), 5.70 (s, 1H), 6.88-6.91 (m, 2H), 6.97 (s, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.99 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.08 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.34-7.49 (m, 7H)

【0176】

I-154

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.69 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.51-2.58 (m, 2H), 3.19 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.07 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 5.18-5.27 (m, 1H), 6.92 (s, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.05 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.32-7.37 (m, 2H), 7.49 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.60-7.64 (m, 2H)

I-155

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.69 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 2.53 (q, J = 6.9 Hz, 2H), 3.77 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.07 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 4.97 (s, 3H), 5.20-5.25 (m, 1H), 5.71 (s, 1H), 6.87-6.93 (m, 3H), 7.07 (dd, J = 1.8, 8.4 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.45-7.50 (m, 2H)

I-156

mp 163-175 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.76 (s, 3H), 3.19 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.20 (s, 2H), 5.68 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.97 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.37-7.47 (m, 7H), 7.68 (m, 2H)

IR (KBr) 3436, 1480, 1415, 1391, 1363, 1233, 1178, 1151, 1079, 1024, 969, 953, 875, 801, 522 $cm^{-1}$

【0177】

I-157

mp 176-178 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.08 (s, 3H), 2.40, (s, 3H), 2.72 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.39 and 7.68 (AB q, J = 8.7 Hz, 4H), 7.47 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 2.1 Hz, 1H)

IR (KBr) 1770, 1747, 1477, 1391, 1366, 1235, 1180, 1152, 1077, 873, 799, 522 $cm^{-1}$

I-158

mp 175-177 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.87 (s, 3H), 3.13 (s, 6H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.81 (s, 3H), 5.22 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.38-7.45 (m, 7H), 7.51-7.53 (m, 2H), 7.67 (m, 2H)

IR (KBr) 1479, 1367, 1180, 1151, 1080, 1019, 966, 876, 798, 525 $cm^{-1}$

I-159

foam

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.44 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.77 (s, 2H), 5.24 (s, 2H), 6.83 (s, 1H), 6.90-7.00 (m, 3H), 7.30-7.48 (m, 5H), 7.37 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.69 (d, J = 8.8 Hz, 2H)

IR (KBr): 1758, 1519, 1481, 1365, 1236, 1176, 1150, 1079, 1013, 963, 872, 798 $cm^{-1}$

【0178】

I-160

m.p. 146-147 ℃

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 3.31 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 4.63 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 6.40 (s, 1H), 6.83-6.90 (m, 4H), 7.05 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.32-7.52 (m, 7H), 8.57 (s, 1H), 9.50 (s, 1H), 12.0-13.9 (br s, 1H)

IR (KBr): 3422, 1728, 1611, 1524, 1489, 1455, 1405, 1247, 1142, 1118, 10
80, 1012, 818, 749, 742, 698 $cm^{-1}$

I-161

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 2.57 (s, 3H), 3.21 (s, 3H)
, 3.56 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 3.80(s, 3H), 4.64 (d, J = 6.5 Hz, 2H), 4.7
4 (s, 2H), 5.54 (t, J = 6.5 Hz, 1H), 6.83 (s, 1H), 6.88 (d, J = 1.5 Hz,
1H), 7.02-7.03 (m, 2H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.69 (d, J = 8.7 Hz, 2
H)

I-162

mp 147-149 ℃

$^1H$ NMR (DMSO-$d_6$) δ 1.73 (s, 3H), 1.77 (s, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.65 (s, 3
H), 4.57 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.60 (s, 2H), 5.86 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.
40 (s, 1H), 6.80 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.87 (dd
, J = 8.7 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 8
.56 (s, 1H), 9.51 (s, 1H), 12.8 (br s, 1H)

IR (KBr): 3483, 3376, 1737, 1612, 1523, 1489, 1460, 1397, 1271, 1231, 11
75, 1120, 1072, 1012, 904, 820 $cm^{-1}$

【0179】

I-163

mp 144-145 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.04 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.59 (s, 3H), 3.75 (s, 3H)
, 4.90 (s, 2H), 5.16 (s, 2H), 5.65 (s, 1H), 6.67 (s, 1H), 6.92 (dd, J =
2.1, 8.4 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.
26-7.47 (m, 7H), 7.61-7.66 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1517, 1477, 1449, 1382, 1361, 1277, 1235, 1199,
1150, 1112, 1079, 1064, 1010, 997 $cm^{-1}$

I-164

mp 80-83 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.99 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.58 (s, 3H)

, 3.75 (s, 3H), 4.93 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 6.67 (s, 1H), 7.12 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34-7.49 (m, 9H), 7.60-7.65 (m, 2H)

I-165

mp 148-151 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.03 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.89 (s, 1H), 4.90 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.64 (s, 1H), 6.67 (s, 1H), 6.88-6.93 (m, 3H), 6.99 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.20-7.49 (m, 7H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1609, 1590, 1519, 1477, 1459, 1381, 1253, 1216, 1156, 1111, 1077, 1066, 1012 $cm^{-1}$

〔0180〕

I-166

mp 199 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.10 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 6.03 (s, 1H), 6.44 (s, 1H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.36-7.49 (m, 8H), 7.52 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67-7.72 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1520, 1486, 1362, 1183, 1152, 1110, 971 $cm^{-1}$

I-167

mp 113-115 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 0.76 (t , J = 7.2 Hz, 3H), 1.46-1.55 (m, 2H), 3.11 (s, 3H), 3.20 (s, 1H), 3.63 (s, 1H), 3.71 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 5.18 (s, 2H), 6.64 (s, 1H), 7.11 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.33-7.50 (m, 9H), 7.60-7.65 (m, 2H)

IR (KBr) 1517, 1475, 1365, 1345, 1293, 1233, 1177, 1149, 1109, 1079, 1017, 956 $cm^{-1}$

I-168

mp 56-58 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 0.76 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.44-1.56 (m, 2H), 3.61 (s, 3H), 3.71 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.74 (s, 3H), 4.86 (s, 1H), 5.15 (s, 2H),

5.63 (s, 1H), 6.65 (s, 1H), 6.88-6.93 (m, 3H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.37-7.50 (m, 7H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1611, 1590, 1519, 1476, 1404, 1379, 1252, 1230, 1110, 1078, 1015 $cm^{-1}$

【0181】

I-169

mp 101-103 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 0.77 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.44-1.55 (m, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.63 (s, 3H), 3.71 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.75 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.48-5.53 (m, 1H), 6.64 (s, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.32-7.38 (m, 3H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.60-7.65 (m, 2H)

IR (KBr) 1514, 1473, 1370, 1359, 1290, 1233, 1174, 1149, 1107, 970 $cm^{-1}$

I-170

mp 64-66 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 0.77 (t , J = 7.5 Hz, 3H), 1.44-1.55 (m, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.21 (s,3H), 3.63 (s, 3H), 3.71 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.75 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.48-5.53 (m, 1H), 6.64 (s, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.32-7.38 (m, 3H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.60-7.65 (m, 2H)

IR (KBr) 3600-2800 (br), 1612, 1590, 1520, 1475, 1462, 1405, 1381, 1285, 1244, 1226, 1110, 1079, 988 $cm^{-1}$

I-171

mp 148-150 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.74 (d, J = 0.9 Hz, 3H), 1.80 (s, 3H), 2.88 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.23 (s, 6H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 4.72 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 5.55 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.39&7.67 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.40 (s, 2H)

IR (KBr) 1514, 1479, 1411, 1366, 1179, 1152, 1079, 1022, 968, 875, 799,

525 $cm^{-1}$

[0182]

I-172

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.45 (tq, J = 7.2, 7.2 Hz, 2H), 2.13 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.68 (d, J = 5.4 Hz, 2H), 5.72 (m, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.07 (br s, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-173

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (br d, J = 6.3 Hz, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.70 (d, J = 5.4 Hz, 2H), 5.77 (m, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96 (br s, 2H), 7.07 (br s, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-174

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.56 (s, 2H), 5.55 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.93 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.01 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.08 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.27 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

[0183]

I-175

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.82 (dd, J = 6.6, 1.5 Hz, 2H), 5.28 (d, J =10.5 Hz, 1H), 5.35 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 5.75 (dt, J = 10.8, 6.6 Hz, 1H), 6.26 (dd, J = 10.5, 10.5 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.66 (ddd, J = 16.5, 10.5, 10.5 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96 (m, 2H), 7.07 (br s, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-176

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.59 (m, 6H), 2.17 (m, 2H), 2.24, (m, 2H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.65 (d, J = 7.2 Hz, 2H), 5.43 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-177

m.p 177-178 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.31 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.39 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 2.76 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.70 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 3.73 (t, J = 5.7 Hz, 2H), 3.78 (s, 3H), 4.67 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.57 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 2940, 1519, 1481, 1362, 1178, 1152, 1079, 818 $cm^{-1}$

【0184】

I-178

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.04 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.05 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 2.12 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.16 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.67 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.45 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.11 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 8.4, 2.4 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-179

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.05 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.10 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.66 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.48 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-180

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.80 (s, 6H), 2.72 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.61 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.10 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

【0185】

I-181

m.p 157-158 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.55-1.65 (m, 6H), 2.18 (m, 2H), 2.23 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.63 d, J = 7.2 Hz, 2H), 5.47 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.96 (br.s, 2H), 7.06 (br.s, 1H), 7.52 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 3410, 2924, 2854, 1609, 1567, 1523, 1490, 1462, 1405, 1254, 1221, 1198, 1119, 1069, 824, 813 $cm^{-1}$

I-182

mp 219-221 ℃

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 2.22 ( t, J = 5.4 Hz, 2H), 2.32 ( t, J = 5.4 Hz, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.56 ( t, J = 5.4 Hz, 2H), 3.61 ( t, J = 5.4 Hz, 2H), 3.64 (s, 3H), 4.59 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.54 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.39 (s, 1H), 6.64 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.73 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.89 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 3392, 2948, 1609, 1586, 1522, 1492, 1271, 1239, 1219, 1118, 1076, 1007, 818 $cm^{-1}$

I-183

mp 149-150 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.03 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.07 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 2.13 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.15 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.48 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.97 (dd, J = 7.8,1.5 Hz, ,1H), 6.97 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3398, 2963, 2934, 1671, 1610, 1523, 1493, 1465, 1407, 1259, 1224, 1118, 1071, 813 $cm^{-1}$

【0186】

I-184

mp 217-218 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.86 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 5.72 (s, 1H), 6.97-7.01 (m, 3H), 7.12 (dd, J = 2.4, 8.4 Hz, 1H), 7.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.34-7.47 (m, 5H), 7.54-7.58 (m, 2H), 7.60 (s, 4H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1605, 1590, 1493, 1298, 1282, 1253, 1206, 1183, 1022 $cm^{-1}$

I-185

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.21 (t, J = 6.9 Hz, 3H), 1.77 (s, 3H),1.82 (s, 3H), 2.38-2.46 (m, 2H), 2.72-2.84 (m, 2H), 3.18(s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.35 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 4.06 (q, J = 6.9Hz, 2H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.52 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.75 (s, 1H), 7.07 (d, J =8.4 Hz, 1H), 7.13 (d.d, J=8.4 & 2.1 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.37 (d, J= 9.0 Hz, 2H), 7.69 (d, J= 9.0 Hz, 2H)

IR (KBr) 1727, 1517, 1469, 1364, 1291, 1234, 1179, 1152, 1118, 1080, 1003 $cm^{-1}$

I-186

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 2.42-2.53 (m, 2H), 2.72-2.86 (m, 2H), 3.35 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.61 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.53 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 5.71 (s, 1H), 6.68 (d.d, J=8.4 & 2.1 Hz, 1H), 6.76 (s, 1H), 6.81 (d, J =2.1 Hz, 1H), 6.91 (d, J=8.4 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.52 (d, J=8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 3419, 1707, 1612, 1518, 1472, 1390, 1225, 1078 $cm^{-1}$

【0187】

I-187

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.55 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.18 (s, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.91 (d.d, J=8.4 & 2.1 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.33-7.48 (m, 5H), 7.71 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.72 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 3442, 1617, 1517, 1485, 1485, 1394, 1357, 1331, 1171, 1124, 107

7, 1067, 1016 $cm^{-1}$

I-188

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 7H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.76 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 1614, 1513, 1482, 1366, 1324, 1177, 1120, 1079, 1065, 1016 $cm^{-1}$

I-189

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 7H), 7.72 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.76 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 1614, 1513, 1482, 1366, 1324, 1177, 1120, 1079, 1065, 1016 $cm^{-1}$

【0188】

I-190

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.82 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.62 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 5.53 (t, J = 8.4 Hz, 1H), 5.71 (s, 1H), 5.85 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.94 (d.d, J = 8.1 & 1.8 Hz, 1H), 6.98 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.77 (d, J = 8.1 Hz, 2H)

IR (KBr) 3552, 3505, 3466, 1613, 1509, 1487, 1397, 1324, 1288, 1245, 1163, 1110, 1065 $cm^{-1}$

I-191

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.02 (s, 6H), 3.48 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.67 (s, 1H), 5.95 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 6.81 (d, J = 8.7 Hz,2H), 6.96 (d.d, J = 8.4 & 2.1 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.10 (d, J =2.1 Hz, 1H), 7.31-7.49 (m, 5H), 7.55 (d, J =8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3543, 3500, 1605, 1526, 1486, 1459, 1245, 1198, 1110, 1070, 999 $cm^{-1}$

I-192

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.02 (s, 6H), 3.47 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.48 (br s, 1H), 4.55 (br s, 1H), 5.15 (s, 2H), 5.70 (s, 1H), 6.76-6.86 (m, 3H), 6.87 (s, 1H), 6.93 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 5H), 7.55 (d, J =8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3433, 1610, 1525, 1475, 1283, 1228, 1197, 1130, 1078, 1013 $cm^{-1}$

【0189】

I-193

mp 160-163 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.60 (s, 3H), 3.60-3.64 (br, 2H), 3.76 (s, 3H), 3.77-3.80 (m, 2H), 5.15 (s, 2H), 5.69 (s, 1H), 5.88 (s, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.90-6.94 (m, 3H), 7.02 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.08 (d , J = 2.1 Hz, 1H), 7.38-7.51 (m, 7H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 1613, 1588, 1519, 1477, 1462, 1397, 1256, 1189, 1117, 1078, 1011 $cm^{-1}$

I-194

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.02 (s, 6H), 3.11 (s, 3H), 3.50 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.43 (br s, 1H), 4.58 (br s, 1H), 5.18 (s, 2H), 6.82 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.92 (s, 1H), 7.16 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.31-7.51 (m, 7H), 7.55 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3432, 1611, 1526, 1476, 1356, 1291, 1232, 1186, 1117, 1079, 1012 $cm^{-1}$

I-195

mp 157-158 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.10 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 5.17 (s, 2H), 6.68 (s, 1H), 7.12 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 9H), 7.63 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

IR (KBr): 1748, 1517, 1476, 1366, 1232, 1150, 1114, 968, 873, 812, 791, 750, 707 $cm^{-1}$

【0190】

I-196

mp 189-191 ℃ (dec)

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 3.45 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 4.25 (s, 2H), 5.12 (s, 2H), 6.66 (dd, J = 8.4, 2.0 Hz, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.77 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.98 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.33-7.54 (m, 7H), 9.01 (s, 1H), 9.54 (br s, 1H)

IR (KBr): 3422, 3245, 1733, 1611, 1596, 1522, 1478, 1400, 1262, 1248, 1222, 1207, 1130, 1084, 1011, 836, 781, 744, 699 $cm^{-1}$

I-197

mp 151-152 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 3.20 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.47 (s, 2H), 4.63 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.51 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 6.68 (s, 1H), 7.05 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 8.9 Hz, 2H)

IR (KBr): 1751, 1517, 1475, 1366, 1234, 1150, 1113, 968, 872, 812, 707 $cm^{-1}$

I-198

mp 155-156 ℃

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 4.25 (s, 2H), 4.54 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 5.49 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 6.65 (dd, J = 8.4, 1.9 Hz, 1H), 6.69 (s, 1H), 6.73 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.85 (s, 1H), 9,55 (s, 1H), 11.2-13.6 (br s, 1H)

IR (KBr): 3411, 3243, 1733, 1611, 1594, 1522, 1477, 1398, 1247, 1207, 1126, 1083, 1015, 835, 788 $cm^{-1}$

【0191】

I-199

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.68 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.88 (s, 1H), 7.16 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.36-7.50 (m, 6H), 7.81 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.98 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1698, 1602, 1481, 1351, 1232, 1182, 1079 $cm^{-1}$

I-200

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.42 (s, 3H), 2.71 (s, 3H), 3.03 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.17 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.19 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.22-7.30 (m, 3H), 7.37 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.41-7.45 (m, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-201

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.38 (s, 3H), 2.67 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.17 (br d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.23-7.30 (m, 3H), 7.34 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

【0192】

I-202

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.30 (s, 3H), 2.38 (s, 6H), 2.74 (s, 3H), 2.94(s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.91 (br s, 2H), 7.37 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.40 (br s, 2H), 7.41 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR ($CHCl_3$) 1610, 1518, 1477, 1370, 1177, 1149, 1082, 970, 873 $cm^{-1}$

I-203

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.34 (s, 6H), 2.66 (s, 3H), 3.15 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.12 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 6.99 (br s, 1H), 7.06 (br s, 2H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.33 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.40 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8

.7 Hz, 2H)

I-204

$^1$H NMR (CDCl3) δ 2.72 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.94 (s, 3H), 5.25 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.11 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J =8.7 Hz, 2H), 7.42 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 8.09 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

【0193】

I-205

mp 153-157 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.70 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.41 (dd, J = 3.3, 2.0 Hz, 1H), 6.49 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.20 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (Nujol) 1605, 1518, 1482, 1375, 1361, 1180, 1150, 1079, 1013, 977, 876, 814, 800 $cm^{-1}$

I-206

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.41 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.99 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.07 (d, J =8.4 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.22-7.34 (m, 3H), 7.40 (br d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-207

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.40 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.11 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.95 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.01 (d, J =8.4 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.19 (br d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.22-7.34 (m, 3H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

【0194】

I-208

mp 230-236 ℃

$^1$H NMR (DMSO-$d_6$) δ 2.25 (s, 3H), 2.35 (s, 6H), 3.31 (s, 3H), 3.65 (s, 3H), 5.00 (s, 2H), 6.39 (s, 1H), 6.69 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 6.84 (d, J =8.7 Hz, 1H), 6.90 (br s, 2H), 7.06 (d, J = 8.4 Hz, 3H), 7.44 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (Nujol) 3475, 3361, 1609, 1579, 1521, 1260, 1244, 1110, 1071, 1012, 988, 822, 782 $cm^{-1}$

I-209

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.35 (s, 6H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.07 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.91 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.95 (dd, J = 8.4, 1.8 Hz, 1H), 7.01 (br s, 1H), 7.02 (d, J =8.4 Hz, 1H), 7.06 (br s, 2H), 7.08 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-210

1H NMR ($CD_3OD$) δ 3.37 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 5.25 (s, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.77 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.89 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.60 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.04 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

【0195】

I-211

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 5.09 (s, 3H), 6.41 (dd, J = 3.3, 1.8 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.47 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 1.8, 1.0 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

I-212

m.p 156-158 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.06 (t, J = 7.4 Hz, 3H), 1.75 (s, 3H), 2.10 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.64 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 5.52 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 6.96 (br.s,

2H), 7.06 (br.s, 1H), 7.53 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

IR (KBr) 3392, 2960, 2934, 1610, 1583, 1568, 1523, 1492, 1465, 1406, 1259, 1241, 1224, 1198, 1118, 1071, 824, 812 $cm^{-1}$

I-213

m.p 175-177 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.77 (s, 3H), 1.80 (s, 6H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.59 (s, 2H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 6.96 (br.s, 2H), 7.06 (br.s, 1H), 7.53 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3449, 2929, 1612, 1581, 1523, 1489, 1403, 1262, 1243, 1228, 1113, 1070, 823, 807 $cm^{-1}$

〔0196〕

I-214

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.66 (tt, J = 6.6,6.6 Hz, 2H), 1.74 (tt, J = 6.6,6.6 Hz, 2H), 2.32 (t, J = 6.6 Hz,2H), 2.34 (t, J = 6.6 Hz,2H), 2.71 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56(s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.62 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.60 (m,1H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 2941, 1610, 1518, 1418, 1365, 1177, 1151, 1079, 847, 818 $cm^{-1}$

I-215

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.57-1.72 (m, 4H), 2.05-2.13 (m, 4H), 2.70 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.23 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 4.48 (s, 2H), 5.86 (s, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 2936, 1610, 1518, 1481, 1365, 1177, 1151, 1079, 818 $cm^{-1}$

I-216

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.74 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 2.54 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 2.70 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.00

(dd, J = 6.6, 2.1 Hz, 1H), 6.84 (s, 1H), 7.28 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.41 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 8.7 Hz, 2H)

IR (KBr) 3282, 3023, 2940, 1609, 1519, 1481, 1365, 1177, 1151, 1079, 970, 815 $cm^{-1}$

【0197】

I-217

m.p 80-85 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.62-1.77 (m, 4H), 2.25-2.39 (m, 4H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.60 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 5.63 (m, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.92 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.95 (br.s, 2H), 7.06 (br.s, 1H), 7.68 (d, J = 8.6 Hz, 2H)

IR (KBr) 3282, 3023, 2940, 1609, 1519, 1481, 1365, 1177, 1151, 1079, 970, 815 $cm^{-1}$

I-218

foam

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 3.45 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 5.69 (br s, 1H), 5.86 (s, 1H), 6.47 (s, 1H), 6.95 (dd, J = 2.1, 8.4 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.34-7.65 (m, 7H), 7.83-7.92 (m, 2H)

IR ($CHCl_3$) 3530, 3022, 1614, 1588, 1500, 1485, 1463, 1405, 1326, 1290, 1249, 1168, 1130, 1117, 1073, 1011 $cm^{-1}$

I-219

foam

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.69 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.51-2.59 (m, 2H), 2.74 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.07 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 5.21 (m, 1H), 6.85 (s, 1H), 7.08 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 2.1, 8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.55-7.69 (m, 2H), 7.81-7.87 (m, 2H)

IR ($CHCl_3$) 3024, 1609, 1519, 1481, 1467, 1396, 1369, 1321, 1272, 1179, 1122, 1082, 1015 $cm^{-1}$

【0198】

I-220

mp 124-126 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.69 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 2.50-2.57 (m, 2H), 3.46 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 4.07 (t, J = 6.9 Hz, 2H), 5.22 (m, 1H), 5.69 (br s, 1H), 5.84 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.93-7.05 (m, 3H), 7.55-7.65 (m, 2H), 7.82-7.91 (m, 2H).

IR (KBr) 3406, 2935, 1587, 1519, 1501, 1488, 1459, 1359, 1323, 1304, 1291, 1274, 1223, 1170, 1126, 1113, 1075, 1018 $cm^{-1}$

I-221

mp 187-189 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.33 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.17 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.12&7.25 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.31 (dd, J = 8.1 Hz, J = 1.5 Hz, 1H), 7.38&7.67 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.42 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 1.5 Hz, 1H)

IR (KBr) 1512, 1474, 1417, 1391, 1356, 1343, 1177, 1149, 1082, 1054, 1013, 976, 961, 939, 867, 854, 844, 820, 812, 799, 523 $cm^{-1}$

I-222

mp 107-112 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.73 (s, 3H), 3.22 (s, 3H), 3.28 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.34 (s, 2H), 6.84 (s, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.30 (dd, J = 8.1 Hz, J = 1.8 Hz, 1H), 7.34-7.41 (m, 3H), 7.46 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.62-7.69 (m, 3H), 8.55 (m, 1H)

IR (KBr) 1474, 1389, 1364, 1179, 1151, 1081, 937, 873, 813, 797, 523 $cm^{-1}$

【0199】

I-223

mp 212-214 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$+$CD_3OD$) δ 3.45 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 4.13 (s, 2H), 6.45 ( s, 1H), 6.90-6.96 (m, 3H), 7.12 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.18-7.26 (m, 2H), 7.48-7.54 (m, 3H), 7.68 (m, 1H), 8.63 (m, 1H)

IR (KBr) 3504, 3272, 1612, 1596, 1574, 1521, 1492, 1463, 1436, 1405, 136 2, 1310, 1265, 1222, 1172, 1116, 1083, 1052, 1017, 828 $cm^{-1}$

I-224

mp 199-200 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.46 (d, J = 0.9 Hz, 3H), 1.77 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 3.90 (m, 2H), 5.25 (m, 1H), 6.04 (br s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.93&7.53 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.00 (m, 2H), 7.05 (m, 1H)

IR (KBr) 3404, 2999, 2932, 1612, 1595, 1522, 1483, 1454, 1432, 1401, 137 6, 1357, 1271, 1223, 1119, 1080, 1055, 1015, 974, 938, 829, 817 $cm^{-1}$

I-225

mp 181-183 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.37 (s, 9H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.93 (br s, 1H), 6.00 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.93&7.54 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 6.99 ( s, 1H), 7.01 (dd, J = 8.4 Hz, J = 1.5 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 8.4 Hz, 1H)

IR (KBr) 3495, 3412, 2959, 2931, 1610, 1568, 1552, 1521, 1499, 1477, 145 9, 1400, 1364, 1319, 1270, 1227, 1192, 1161, 1116, 1102, 1090, 1052, 101 9, 942, 833, 817, 588 $cm^{-1}$

【0200】

I-226

mp 154-156 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.33 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.90 (s, 2H) , 4.68 (s, 1H), 5.97 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.60 (s, 1H), 6.90-6.98 (m, 3H), 7.10 (s, 5H), 7.41 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.53 (m, 2H)

IR (KBr) 3462, 3368, 1611, 1550, 1521, 1499, 1472, 1455, 1437, 1401, 136

2, 1321, 1293, 1267, 1229, 1187, 1174, 1164, 1118, 1077, 1050, 1011, 821 $cm^{-1}$

I-227

mp 172-174 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.38 (d, J = 1.2 Hz, 3H), 1.76 (s, 3H), 3.44 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.87 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 5.08 (br s, 1H), 5.26 (m, 1H), 6.08 (s, 1H), 6.45 (s, 1H), 6.94&7.53 (ABq, J = 8.7 Hz, 4H), 7.11-7.14 (m, 2H), 7.62 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 8.87 (s, 1H)

IR (KBr) 3412, 1613, 1520, 1478, 1458, 1443, 1404, 1360, 1346, 1290, 1270, 1224, 1200, 1171, 1119, 1078, 1054, 945 $cm^{-1}$

I-228

mp 173-175 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.69 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 2.50-2.61 (m, 2H), 3.20 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 4.08 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 5.21-5.25 (m, 1H), 6.73 (s, 1H), 7.03-7.18 (m, 2H), 7.23-7.25 (m, 2H), 7.37 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.69 (d, J = 8.8 Hz, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 3100-2800 (br), 1610, 1527, 1523, 1477, 1432, 1365, 1240, 1172, 1160, 955, 923 $cm^{-1}$

〔0201〕

I-229

mp 148-150 ℃

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.70 (s, 3H), 1.77 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 2.48-2.62 (m, 2H), 3.38 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 4.09 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 4.84 (br, 1H), 5.19-5.22 (m, 1H), 5.70 (s, 1H), 6.71-6.96 (m, 5H), 7.55 (d, J = 8.2 Hz, 2H)

IR (KBr) 3700-3200 (br), 3100-2800 (br), 1612, 1584, 1560, 1448, 1428, 1390, 1339, 1315, 1284, 1246, 1173, 1160, 1123, 1018, 999 $cm^{-1}$

I-230

mp 194-195 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.10 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 3.10 (s, 3H), 3.21 (s, 3H), 3.36 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 5.13 (s, 2H), 6.73 (s, 1H), 7.14-7.18 (m, 8H), 7.69 (d, J = 9.0 Hz, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 3100-2800 (br), 1516, 1475, 1360, 1332, 1292, 1266, 1228, 1199, 1174, 1151, 1119, 1098, 1084, 1005, 968 $cm^{-1}$

I-231

mp 178-180 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.09 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 3.37 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.97 (br s, 1H), 5.10 (s, 2H), 5.67 (br, 1H), 6.70-6.75 (m, 2H), 6.86-7.03 (m, 3H), 7.22-7.26 (m, 2H), 7.32-7.34 (m, 2H), 7.54 (d, J = 8.2 Hz, 2H)

IR (KBr) 3600-3200 (br), 3100-2800 (br), 1611, 1519, 1479, 1463, 1388, 1339, 1314, 1286, 1258, 1246, 1225, 1128, 1098, 1077, 1007 $cm^{-1}$

【０２０２】

I-232

mp 177-179 ℃

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.54 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 7.15 (d, J = 8.4 Hz, 2H),7.30-7.49 (m, 9H), 7.53-7.59 (m, 2H)

IR (CHCl3) 1516, 1476, 1368, 1266, 1176, 1118, 1077, 1080., 1013, 970, 876, 820 $cm^{-1}$

I-233

amorphous powder

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.54 (s, 3H), 3.46 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.15 (s, 2H), 5.67 (br s, 1H), 5.90 (s, 1H), 6.46 (s, 1H), 6.95 (d.d, J = 1.8 &8.1 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 8.1 Hz, 1H),7.09 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.31-7.49 (m, 7H), 7.55-7.62 (m, 2H)

IR ($CHCl_3$) 3526, 1517, 1483, 1414, 1389, 1289, 1246, 1192, 1114., 1070, 1010, 937, 818 $cm^{-1}$

I-234

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.73 (s, 3H), 3.24 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 4.64 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 5.49 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 6.87 (s, 1H), 7.09 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.35 (d.d, J = 8.4 & 2.1 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.13 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

〔0203〕

I-235

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.69 (s, 3H), 3.14 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.80 (s, 3H), 5.20(s, 2H), 6.89 (s, 1H), 7.16 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.36-7.51 (m, 6H), 7.75 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.23 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 3427, 1724, 1685, 1606, 1509, 1481, 1369, 1272, 1235, 1179, 1120, 1084, 1017 $cm^{-1}$

I-236

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.46 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.16 (s, 3H), 6.50 (s, 3H), 6.96 (dd, J = 8..4 & 2.1 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.34-7.50 (m, 5H), 7.75 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 8.17 (d, J = 8.1 Hz, 2H)

I-237

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 3.44 (s, 3H), 3.76 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 5.16 (s, 2H), 5.69 (s, 1H), 5.89 (s, 1H), 6.49 (s, 1H), 6.96 (d.d, J = 8..4 & 2.1 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.09 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.32-7.50 (m, 5H), 7.73 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.13 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 3497, 3443, 1708, 1608, 1585, 1487, 1460, 1443, 1395, 1281, 1113, 1068, 1008 $cm^{-1}$

〔0204〕

I-238

$^1$H NMR ($CDCl_3$) δ 2.69 (s, 3H), 3.13 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.79 (s, 3H)

, 3.96 (s, 3H), 5.19 (s, 2H), 6.87 (s, 1H), 7.15 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.31-7.50 (m, 7H), 7.71 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 8.13 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1719, 1608, 1481, 1366, 1278, 1118, 1080, 1017 $cm^{-1}$

I-239

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.38 (s, 3H), 2.68 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.53 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.96 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 6.87 (s, 1H), 7.15 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.34 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 8.13 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1718, 1607, 1519, 1481, 1355, 1280, 1232, 1182, 1121, 1079, 1018 $cm^{-1}$

I-240

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.70 (s, 3H), 3.03 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.18 (s, 2H), 6.78-6.89 (broad, 1H), 6.86 (s, 1H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.31-7.49 (m, 8H), 7.55 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1604, 1526, 1483, 1395, 1374, 1360, 1292, 1231, 1177, 1119, 1078, 1014 $cm^{-1}$

【0205】

I-241

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 2.37 (s, 3H), 2.69 (s, 3H), 3.05 (s, 3H), 3.12 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 5.14 (s, 2H), 6.85 (s, 1H), 6.81-6.91 (broad, 2H), 7.14 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.21(d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.40 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.4 Hz, 2H)

IR (KBr) 1605, 1529, 1484, 1396, 1356, 1275, 1233, 1178, 1121, 1078, 1016 $cm^{-1}$

I-242

$^1H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.76 (s, 3H), 1.81 (s, 3H), 2.73 (s, 3H), 3.03 (s, 6H), 3.22 (s, 3H), 3.55 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 4.63 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 5.49 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 6.75-6.91 (broad, 2H), 6.86 (s, 1H), 7.08 (d, J

= 8.7 Hz, 1H), 7.34(d.d, J = 8.7 & 2.1 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 2.1 Hz, 1H ), 7.55 (d, J = 8.7 Hz, 1H)

IR (KBr) 1609, 1529, 1482, 1363, 1235, 1178, 1117, 1078, 1013 $cm^{-1}$

I-243

IR (KBr) 3409, 1608, 1509, 1464, 1367, 1230, 1175, 1149, 1079, 1018 $cm^{-1}$

【0206】

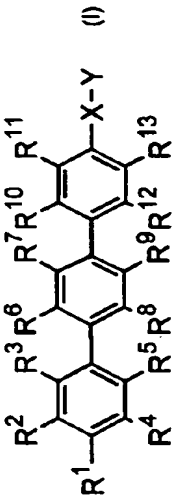
I-244

$^{1}H$ NMR ($CDCl_3$) δ 1.72 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 2.55 (m, 2H), 3.22 (s, 3H) , 3.45 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 4.07 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 4.46 (d, J = 10. 5 Hz, 1H), 4.51 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 4.66 (d, J = 10.5 Hz, 1H), 4.75 (d , J = 10.5 Hz, 1H), 5.24 (br s, 1H), 6.84 (s, 1H), 6.95 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.02 (s, 1H), 7.21 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 9.0 Hz, 2H)7.7 1 (d, J = 9.0 Hz, 2H)

IR (KBr) 3307, 1609, 1509, 1465, 1364, 1235, 1180, 1152, 1082, 1021 $cm^{-1}$

【0207】

【表1】



(I)

| No. | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | $R^4$ | $R^5$ | $R^6$ | $R^7$ | $R^8$ | $R^9$ | $R^{10}$ | $R^{11}$ | $R^{12}$ | $R^{13}$ | X | Y |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-245 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | OMe | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-246 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | OMe | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-247 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | OMe | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-248 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | OMe | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-249 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | OMe | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-250 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-251 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-252 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-253 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-254 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-255 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-256 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-257 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-258 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-259 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-260 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |

【0208】

【表2】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-261 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-262 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-263 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-264 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-265 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-266 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-267 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-268 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-269 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-270 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-271 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-272 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-273 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-274 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-275 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-276 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-277 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-278 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-279 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-280 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-281 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |

【0209】

【表3】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-282 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-283 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-284 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-285 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-286 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-287 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-288 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-289 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-290 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-291 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-292 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-293 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-294 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-295 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-296 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-297 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-298 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-299 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-300 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-301 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-302 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |

【0210】

【表4】

| | | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-303 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-304 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-305 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-306 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-307 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-308 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-309 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-310 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-311 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-312 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-313 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-314 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-315 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-316 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-317 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-318 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-319 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-320 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-321 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-322 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-323 | OH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |

【0211】

【表5】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-324 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-325 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-326 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-327 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-328 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-329 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-330 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-331 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-332 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-333 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-334 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-335 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-336 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-337 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-338 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-339 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-340 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-341 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-342 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-343 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-344 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |

【0212】

【表6】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-345 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-346 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-347 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-348 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-349 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-350 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-351 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-352 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-353 | OH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-354 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-355 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-356 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-357 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-358 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-359 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-360 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-361 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-362 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-363 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-364 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-365 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |

【0213】

【表7】

| | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-366 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-367 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-368 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-369 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-370 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-371 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-372 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-373 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-374 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-375 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-376 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-377 | OH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-378 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-379 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-380 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-381 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-382 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-383 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-384 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-385 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-386 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |

【0214】

【表8】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-387 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-388 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-389 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-390 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-391 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-392 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-393 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-394 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-395 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-396 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-397 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-398 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-399 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-400 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-401 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-402 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-403 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-404 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-405 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-406 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-407 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |

【0215】

【表9】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-408 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-409 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-410 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-411 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-412 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-413 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-414 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-415 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-416 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-417 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-418 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-419 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-420 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-421 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-422 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-423 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-424 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-425 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-426 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-427 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-428 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |

【0216】

【表10】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-429 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-430 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-431 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-432 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-433 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-434 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-435 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-436 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-437 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-438 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-439 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-440 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-441 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-442 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-443 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-444 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-445 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-446 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-447 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-448 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-449 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |

【0217】

【表11】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-450 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-451 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-452 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-453 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-454 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-455 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-456 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-457 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-458 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-459 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-460 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-461 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-462 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-463 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-464 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-465 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-466 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-467 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-468 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-469 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-470 | OMs | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |

【0218】

【表112】

| | | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-471 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-472 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-473 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-474 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-475 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-476 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-477 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-478 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-479 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-480 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-481 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-482 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-483 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-484 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-485 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-486 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-487 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-488 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-489 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-490 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-491 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |



出証特平09－3070690

【0219】

【表13】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-492 | OMe | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-493 | OMe | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-494 | OMe | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-495 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-496 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-497 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-498 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-499 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-500 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMe | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-501 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMe | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-502 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMe | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-503 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMe | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-504 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMe | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-505 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-506 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-507 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-508 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-509 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-510 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-511 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-512 | OMe | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |

【0220】

【表14】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-513 | OMs | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C{\equiv}CMe$ |
| I-514 | OMs | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-515 | OMs | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-516 | OMs | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-517 | OMs | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-518 | OMs | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C{\equiv}CMe$ |
| I-519 | OMs | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-520 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-521 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-522 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C{\equiv}CMe$ |
| I-523 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-524 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-525 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-526 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-527 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C{\equiv}CMe$ |
| I-528 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-529 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-530 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-531 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-532 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C{\equiv}CMe$ |
| I-533 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |

【0221】

【表15】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-534 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-535 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-536 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-537 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-538 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-539 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-540 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-541 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-542 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-543 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-544 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-545 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-546 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-547 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-548 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-549 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-550 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-551 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-552 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-553 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-554 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |

【0222】

【表16】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-555 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-556 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-557 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-558 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-559 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-560 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-561 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-562 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-563 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-564 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-565 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-566 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-567 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-568 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-569 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-570 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-571 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-572 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-573 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-574 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMe | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-575 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMe | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |

【0223】

【表17】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-576 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-577 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-578 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-579 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-580 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-581 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-582 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-583 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-584 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-585 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-586 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-587 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-588 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-589 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-590 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-591 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-592 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-593 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-594 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-595 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-596 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |

【0224】

【表18】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-597 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-598 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-599 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-600 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-601 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-602 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-603 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-604 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-605 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-606 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-607 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-608 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-609 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-610 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-611 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-612 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-613 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-614 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-615 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-616 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-617 | F | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |

【0225】

【表19】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-618 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-619 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-620 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-621 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-622 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-623 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-624 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-625 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-626 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-627 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-628 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-629 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-630 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-631 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-632 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-633 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-634 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-635 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-636 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-637 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-638 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |

【0226】

【表20】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-639 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-640 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-641 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-642 | F | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-643 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-644 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-645 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-646 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-647 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-648 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-649 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-650 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-651 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-652 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-653 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-654 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-655 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-656 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-657 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-658 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-659 | F | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |

【0227】

【表21】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-660 | F | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-661 | F | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-662 | F | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-663 | F | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-664 | F | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-665 | F | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-666 | F | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-667 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-668 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-669 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-670 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-671 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-672 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-673 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-674 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-675 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-676 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-677 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-678 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-679 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-680 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |

【0228】

【表22】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-681 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | 0 | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-682 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | 0 | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-683 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | 0 | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-684 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | 0 | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-685 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | 0 | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-686 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | 0 | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-687 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | 0 | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-688 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | 0 | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-689 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | 0 | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-690 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | 0 | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-691 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | 0 | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-692 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | 0 | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-693 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | 0 | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-694 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | 0 | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-695 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | 0 | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-696 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | 0 | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-697 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | 0 | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-698 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | 0 | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-699 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | 0 | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-700 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | 0 | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-701 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | 0 | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |

【0229】

【表23】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-702 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-703 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-704 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-705 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-706 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-707 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-708 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-709 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-710 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-711 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-712 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-713 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-714 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-715 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-716 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-717 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-718 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-719 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-720 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-721 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-722 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |

【0230】

【表24】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-723 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-724 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-725 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-726 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-727 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-728 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-729 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-730 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-731 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-732 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-733 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-734 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-735 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-736 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-737 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-738 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-739 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-740 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-741 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-742 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-743 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | OMe | OMe | Me | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |

【0231】

【表25】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-744 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-745 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-746 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-747 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-748 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-749 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-750 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-751 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-752 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-753 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-754 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-755 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-756 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-757 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-758 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-759 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-760 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-761 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-762 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-763 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-764 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |

【0232】

【表26】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-765 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-766 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-767 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-768 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-769 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-770 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-771 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-772 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-773 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-774 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-775 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-776 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-777 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-778 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-779 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-780 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-781 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-782 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-783 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-784 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-785 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |

【0233】

【表27】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-786 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-787 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-788 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-789 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-790 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-791 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-792 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-793 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-794 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-795 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-796 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-797 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-798 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-799 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-800 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-801 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-802 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-803 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-804 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-805 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-806 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |

【0234】

【表28】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-807 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-808 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-809 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-810 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-811 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-812 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-813 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-814 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-815 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-816 | $-OCH_2O-*$ | H | H | * | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-817 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-818 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-819 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-820 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-821 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-822 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-823 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-824 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-825 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-826 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-827 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |

【0235】

【表29】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-828 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-829 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-830 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-831 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-832 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-833 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-834 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-835 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-836 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-837 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-838 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-839 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-840 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-841 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-842 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-843 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-844 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-845 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-846 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-847 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMe | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-848 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMe | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |

【0236】

【表30】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-849 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-850 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-851 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-852 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-853 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-854 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-855 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-856 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-857 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-858 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-859 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-860 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-861 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-862 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-863 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-864 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-865 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-866 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-867 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-868 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-869 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |

【0237】

【表31】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-870 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-871 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-872 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-873 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-874 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-875 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-876 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-877 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-878 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-879 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-880 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-881 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-882 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-883 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-884 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-885 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-886 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-887 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-888 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-889 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-890 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |

【0238】

【表32】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-891 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-892 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-893 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-894 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-895 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-896 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-897 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMe | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-898 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMe | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-899 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMe | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-900 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMe | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-901 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | OMe | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-902 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-903 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-904 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-905 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-906 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-907 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-908 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-909 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-910 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-911 | $NMe_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |

【0239】

【表33】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-912 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-913 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-914 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-915 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-916 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-917 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-918 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-919 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-920 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-921 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-922 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-923 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-924 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-925 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-926 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-927 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-928 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-929 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-930 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-931 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-932 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |

【0240】

【表34】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-933 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-934 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-935 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-936 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-937 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-938 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-939 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-940 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-941 | $NMe_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-942 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-943 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-944 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-945 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-946 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-947 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-948 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-949 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-950 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-951 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-952 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-953 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |

【0241】

【表35】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-954 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-955 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-956 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-957 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-958 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-959 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-960 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-961 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-962 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-963 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-964 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-965 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-966 | $NMe_2$ | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-967 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-968 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-969 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-970 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-971 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-972 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $OM_8$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-973 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $OM_8$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-974 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | $OM_8$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |

【0242】

【表36】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-975 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | OMe | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-976 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | OMe | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-977 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-978 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-979 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-980 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-981 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-982 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-983 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-984 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-985 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-986 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-987 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-988 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-989 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-990 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-991 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | OH | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-992 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-993 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-994 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-995 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |

【0243】

【表37】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-996 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-997 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-998 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-999 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1000 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1001 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1002 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1003 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1004 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1005 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1006 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1007 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1008 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1009 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1010 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1011 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1012 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1013 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1014 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1015 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1016 | COOH | H | H | H | H | H | OMe | OMe | COOH | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |

【0244】

【表38】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-1017 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1018 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1019 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1020 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1021 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1022 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1023 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1024 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1025 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1026 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1027 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1028 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1029 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1030 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1031 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1032 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1033 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1034 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1035 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1036 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1037 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |

【0245】

【表39】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-1038 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1039 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1040 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1041 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | $CH_2OH$ | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1042 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1043 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1044 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1045 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1046 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1047 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1048 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1049 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1050 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1051 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1052 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1053 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1054 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1055 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1056 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1057 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1058 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |

【0246】

【表40】

| | | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-1059 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1060 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1061 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1062 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1063 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1064 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1065 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1066 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | Me | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1067 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1068 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1069 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1070 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1071 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1072 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1073 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1074 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1075 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1076 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1077 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1078 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1079 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |

【0247】

【表41】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-1080 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1081 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1082 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1083 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1084 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1085 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1086 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1087 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1088 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1089 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1090 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1091 | COOH | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1092 | COOH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1093 | COOH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1094 | COOH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1095 | COOH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1096 | COOH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1097 | COOH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1098 | COOH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1099 | COOH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1100 | COOH | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |

【0248】

【表42】

| | | | | | | | | | | | | | |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| I-1101 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | OMs | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1102 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1103 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1104 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1105 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1106 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | COOH | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1107 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1108 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1109 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1110 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1111 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | $CH_2OH$ | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1112 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CMe_2$ |
| I-1113 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1114 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2CH=CCl_2$ |
| I-1115 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C\equiv CMe$ |
| I-1116 | COOH | H | H | H | H | F | OMe | OMe | OH | H | H | F | O | $-CH_2C_6H_4-4-Me$ |
| I-1117 | $NO_2$ | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1118 | OMs | $NO_2$ | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1119 | OMs | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | $NO_2$ | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1120 | CN | H | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |
| I-1121 | OMs | CN | H | H | H | H | OMe | OMe | H | H | H | OMs | O | $-(CH_2)_2CH=CMe_2$ |

表中、－$OCH_2O$－＊および＊は一緒になって環を形成することを示す。

【0249】

試験例1　マウス脾細胞の試験管内マイトジェン反応における抑制効果

96ウェルマイクロタイタープレートの各ウェルにC3H／HeNマウス脾細胞$5\times10^5$個を0．1ml1の10％牛胎仔血清含有RPMI1640培地（炭酸水素ナトリウム2mM、ペニシリン50単位／ml、ストレプトマイシン50μg／ml、および2－メルカプトエタノール$5\times10^{-5}$Mを添加）に浮遊させたものを加え、その各ウェルにマイトジェンとしてコンカナバリンA（ConA）5μg／mlまたはリポポリサッカライド（LPS）10μg／mlと本発明に係る化合物を種々の濃度で加え、各ウェルの最終容量を0．2mlとした。各本発明に係る化合物はジメチルスルホキシド（DMSO）に溶解し、上記RPMI1640培地にて希釈し、最終濃度100ng／ml以下になるように添加した。96ウェルマイクロタイイタープレートは、湿度100％、二酸化炭素5％、空気95％に保持された培養器内で37℃3日間培養した。その後、6mg／mlのMTT[3－（4，5－ジメチルチアゾール－2イル）－2，5－，ジフェニルテトラゾリウムブロマイド]（シグマ製）溶液25μlを各ウェルに加え、37℃にて4時間同一条件下で培養した。培養終了後、生成したホルマザンを、20％ドデシルナトリウムスルホン酸（SDS）の0．02N－塩酸溶液50μlを加え、37℃で24時間放置して溶解させた。生細胞数に比例して生成したホルマザンの吸光強度（OD）を570nmのフィルターを装着したイムノリーダー（InterMed）で測定した（ザ・ジャーナル・オブ・イムノロジカル・メソッド（The Journal of immnological method）、65巻、55－63頁（1983年））。本発明に係る化合物の濃度と吸光強度との相関より50％の細胞増殖阻止濃度（$IC_{50}$値）を算出した。

【0250】

試験例2　EL4細胞に対する抗細胞増殖効果

96ウェルマイクロタイタープレートの各ウェルにマウス胸腺腫株EL4細胞を$4\times10^4$個／0．1mlのスケールで加え、本発明に係る化合物を0～50

００ｎｇ／ｍｌとなるように０．１ｍｌ添加した。３日間培養し、試験例１で示したＭＴＴ法によりその$IC_{50}$を算出した。

試験例１および２の結果を表４３に示す。

【0251】

【表43】

| 化合物 | ConA IC50(ng/ml) | LPS IC50(ng/ml) | EL-4 IC50(ng/ml) |
|---|---|---|---|
| I－1 | 0.86 | 1.92 | 8.56 |
| I－12 | 1.3 | 2.8 | 46.2 |
| I－18 | 17.5 | 44.0 | 170 |
| I－22 | 5.62 | 4.26 | 6.20 |
| I－25 | 48.9 | 83.8 | 139 |
| I－29 | 37.2 | 312 | 70 |
| I－35 | 19.5 | 39.4 | 140 |
| I－40 | 6.1 | 16.5 | 37.4 |
| I－41 | 0.73 | 1.74 | 4.89 |
| I－43 | 313 | 581 | 353 |
| I－45 | 44 | 76 | 64 |
| I－46 | 43.0 | 44.0 | 77.3 |
| I－47 | 78.6 | 188 | 1000 |
| I－49 | 8.89 | 16.2 | 31.7 |
| I－50 | 3.83 | 9.2 | 11.9 |
| I－51 | 6.6 | 14.7 | 70.0 |
| I－53 | 35.3 | 105 | 440 |
| I－54 | 43.0 | 44.0 | 77.3 |
| I－55 | 183 | 342 | 4460 |
| I－59 | 8.5 | 22.4 | 140 |
| I－62 | 29.2 | 25.0 | 23.4 |
| I－63 | 12.8 | 26.5 | 15.9 |
| I－66 | 0.22 | 0.35 | 0.48 |
| I－71 | 4.56 | 14.2 | 31.2 |
| I－85 | 164 | 163 | 500 |
| I－88 | 28.3 | 49.7 | 50.2 |
| I－91 | 174 | 283 | 318 |

【0252】

表43から、本発明に係る化合物が免疫抑制作用および抗アレルギー作用を有していることが分かる。

【0253】

製剤例1　錠剤

| | |
|---|---|
| 本発明化合物 | 15mg |
| デンプン | 15mg |
| 乳糖 | 15mg |
| 結晶性セルロース | 19mg |
| ポリビニルアルコール | 3mg |
| 蒸留水 | 30ml |
| ステアリン酸カルシウム | 3mg |

ステアリン酸カルシウム以外の成分を均一に混合し、破砕造粒して乾燥し、適当な大きさの顆粒剤とした。次にステアリン酸カルシウムを添加して圧縮成形して錠剤とした。

【0254】

【発明の効果】

以上の試験例から明らかなように、本発明に係る化合物は強い免疫抑制作用および／または抗アレルギー作用を示す。従って、本発明に係る化合物は免疫抑制剤および／または抗アレルギー剤として非常に有用である。

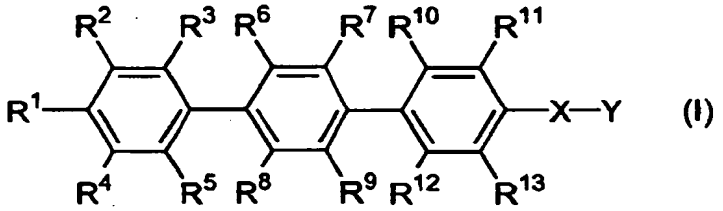
【書類名】　要約書

【要約】

【課題】優れた免疫抑制作用および／または抗アレルギー作用を有し、医薬品として有用な化合物を提供すること。

【解決手段】式（Ｉ）：

【化１】




で示される化合物もしくはその製薬上許容される塩またはそれらの水和物およびその製造方法、本化合物を含有する医薬組成物を提供する。

【選択図】なし

【書類名】　職権訂正データ
【訂正書類】　特許願

＜認定情報・付加情報＞
【特許出願人】　申請人
　【識別番号】　000001926
　【住所又は居所】　大阪府大阪市中央区道修町３丁目１番８号
　【氏名又は名称】　塩野義製薬株式会社
【代理人】
　【識別番号】　100103230
　【住所又は居所】　大阪府大阪市中央区道修町３丁目１番８号　塩野義製薬株式会社特許部内
　【氏名又は名称】　高山　裕貢


出証特平０９－３０７０６９０

# 出　願　人　履　歴　情　報

識別番号　　〔000001926〕

1．変更年月日　　1990年　8月23日
［変更理由］　新規登録
住　所　　大阪府大阪市中央区道修町3丁目1番8号
氏　名　　塩野義製薬株式会社

THIS PAGE BLANK (USPTO)